

Document made available under the Patent Cooperation Treaty (PCT)

International application number: PCT/JP05/006887

International filing date: 30 March 2005 (30.03.2005)

Document type: Certified copy of priority document

Document details: Country/Office: JP
Number: 2004-106668
Filing date: 31 March 2004 (31.03.2004)

Date of receipt at the International Bureau: 16 June 2005 (16.06.2005)

Remark: Priority document submitted or transmitted to the International Bureau in compliance with Rule 17.1(a) or (b)



World Intellectual Property Organization (WIPO) - Geneva, Switzerland
Organisation Mondiale de la Propriété Intellectuelle (OMPI) - Genève, Suisse

日 本 国 特 許 庁
JAPAN PATENT OFFICE

別紙添付の書類に記載されている事項は下記の出願書類に記載されている事項と同一であることを証明する。

This is to certify that the annexed is a true copy of the following application as filed with this Office.

出 願 年 月 日
Date of Application: 2 0 0 4 年 3 月 3 1 日

出 願 番 号
Application Number: 特 願 2 0 0 4 - 1 0 6 6 6 8

パリ条約による外国への出願
に用いる優先権の主張の基礎
となる出願の国コードと出願
番号
The country code and number
of your priority application,
to be used for filing abroad
under the Paris Convention, is

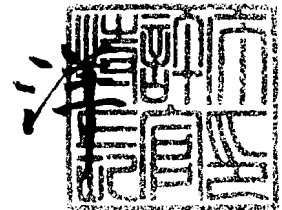
J P 2 0 0 4 - 1 0 6 6 6 8

出 願 人
Applicant(s): 日 本 曹 達 株 式 会 社

2 0 0 5 年 6 月 1 日

特許庁長官
Commissioner,
Japan Patent Office

小 川



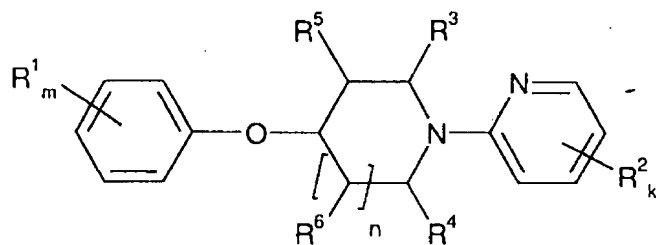
【書類名】 特許願
【整理番号】 04P000020
【あて先】 特許庁長官殿
【発明者】
 【住所又は居所】 神奈川県小田原市高田3 4 5 日本曹達株式会社 小田原研究所
 内
 【氏名】 浜本 伊佐美
【発明者】
 【住所又は居所】 神奈川県小田原市高田3 4 5 日本曹達株式会社 小田原研究所
 内
 【氏名】 高橋 淳
【発明者】
 【住所又は居所】 神奈川県小田原市高田3 4 5 日本曹達株式会社 小田原研究所
 内
 【氏名】 矢野 真樹郎
【発明者】
 【住所又は居所】 神奈川県小田原市高田3 4 5 日本曹達株式会社 小田原研究所
 内
 【氏名】 花井 大輔
【特許出願人】
 【識別番号】 0000004307
 【氏名又は名称】 日本曹達株式会社
【代理人】
 【識別番号】 100113860
 【弁理士】
 【氏名又は名称】 松橋 泰典
【手数料の表示】
 【予納台帳番号】 005256
 【納付金額】 21,000円
【提出物件の目録】
 【物件名】 特許請求の範囲 1
 【物件名】 明細書 1
 【物件名】 要約書 1
 【包括委任状番号】 0303064

【書類名】 特許請求の範囲

【請求項 1】

式【1】

【化1】



【1】

【式中、R¹は、ヒドロキシル基、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、ホルミル基、G¹で置換されても良いC₁₋₆アルキル基、C₁₋₆ハロアルキル基、C₂₋₆アルケニル基、C₂₋₆アルキニル基、C₁₋₆アルキルカルボニル基、C₁₋₆アルコキシ基、C₁₋₆ハロアルコキシ基、C₂₋₆アルケニルオキシ基、C₂₋₆ジハロアルケニルオキシ基、C₂₋₆アルキニルオキシ基、C₄₋₆アレニルオキシ基、ベンジルオキシ基、ベンゾイルオキシ基、ナフチルメチルオキシ基、C₁₋₆アルコキシカルボニル基、C₁₋₆アルキルカルボニルオキシ基、C₁₋₆アルコキシカルボニルオキシ基、C₁₋₆アルキルチオカルボニルオキシ基、G²で置換されても良いアミノ基、C₁₋₆アルキルチオ基、C₁₋₆ハロアルキルチオ基、C₁₋₆アルキルスルフィニル基、C₁₋₆ハロアルキルスルフィニル基、C₁₋₆アルキルスルホニル基、C₁₋₆ハロアルキルスルホニル基、C₁₋₆アルキルスルホニルオキシ基、またはC₁₋₆ハロアルキルスルホニルオキシ基を表し、mは0または1～5の整数を表す。

R²は、ハロゲン原子、ニトロ基、C₁₋₆アルキル基、C₁₋₆アルコキシ基、C₁₋₆ハロアルキル基、またはC₁₋₆ハロアルコキシ基を表し、kは1～4の整数を表す。

R³、R⁴、R⁵およびR⁶はそれぞれ独立して、水素原子、またはC₁₋₆アルキル基を表し、これらは一緒になって飽和環を形成し、全体として橋かけ環を形成してもよい。

n=0または1を表す。

G¹は、ヒドロキシル基、ハロゲン原子、カルボニル基、またはC₁₋₆アルコキシ基を表す。

G²は、ヒドロキシル基、C₁₋₆アルコキシ基、C₁₋₆アルコキシアルコキシ基を表す。

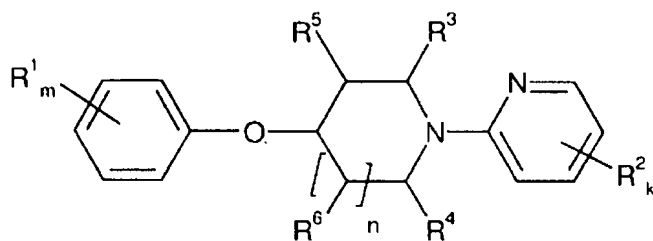
G³は、C₁₋₆アルキル基、ジC₁₋₆アルキル基、C₁₋₆アルキルカルボニル基、C₁₋₆アルキルスルホニル基、ジC₁₋₆アルキルスルホニル基、C₁₋₆ハロアルキルスルホニル基、またはジC₁₋₆ハロアルキルスルホニル基を表す。】

で表される化合物。

【請求項 2】

式【1】

【化2】



【1】

〔式中、 R^1 は、ヒドロキシ基、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、ホルミル基、 G^1 で置換されても良い C_{1-6} アルキル基、 C_{1-6} ハロアルキル基、 C_{2-6} アルケニル基、 C_{2-6} アルキニル基、 C_{1-6} アルキルカルボニル基、 C_{1-6} アルコキシ基、 C_{1-6} ハロアルコキシ基、 C_{2-6} アルケニルオキシ基、 C_{2-6} ジハロアルケニルオキシ基、 C_{2-6} アルキニルオキシ基、 C_{4-6} アレニルオキシ基、ベンジルオキシ基、ベンゾイルオキシ基、ナフチルメチルオキシ基、 C_{1-6} アルコキシカルボニル基、 C_{1-6} アルキルカルボニルオキシ基、 C_{1-6} アルコキシカルボニルオキシ基、 C_{1-6} アルキルチオカルボニルオキシ基、 G^2 で置換されても良いアミノ基、 C_{1-6} アルキルチオ基、 C_{1-6} ハロアルキルチオ基、 C_{1-6} アルキルスルフィニル基、 C_{1-6} ハロアルキルスルフィニル基、 C_{1-6} アルキルスルホニル基、 C_{1-6} ハロアルキルスルホニル基、 C_{1-6} アルキルスルホニルオキシ基、または C_{1-6} ハロアルキルスルホニルオキシ基を表し、 m は0または1～5の整数を表す。

R^2 は、ハロゲン原子、ニトロ基、 C_{1-6} アルキル基、 C_{1-6} アルコキシ基、 C_{1-6} ハロアルキル基、または C_{1-6} ハロアルコキシ基を表し、 k は0または1～4の整数を表す。

R^3 、 R^4 、 R^5 および R^6 はそれぞれ独立して、水素原子、または C_{1-6} アルキル基を表し、これらは一緒になって飽和環を形成し、全体として橋かけ環を形成してもよい。

$n=0$ または1を表す。

G^1 は、ヒドロキシ基、ハロゲン原子、カルボニル基、または C_{1-6} アルコキシ基を表す。

G^2 は、ヒドロキシ基、 C_{1-6} アルコキシ基、 C_{1-6} アルコキシアルコキシ基を表す。

G^3 は、 C_{1-6} アルキル基、ジ C_{1-6} アルキル基、 C_{1-6} アルキルカルボニル基、 C_{1-6} アルキルスルホニル基、ジ C_{1-6} アルキルスルホニル基、 C_{1-6} ハロアルキルスルホニル基、またはジ C_{1-6} ハロアルキルスルホニル基を表す。〕

で表される有害生物防除剤。

【書類名】明細書

【発明の名称】環状アミン化合物および有害生物防除剤

【技術分野】

【0001】

本発明は、新規な環状アミン化合物およびそれらを有効成分として含有する有害生物防除剤に関する。

【背景技術】

【0002】

従来より、多数の殺虫剤、殺ダニ剤が使用されているが、その効力が不十分であったり、薬剤抵抗性問題によりその使用が制限されたり、また、植物体に薬害や汚染を生じたり、あるいは人畜魚類などに対する毒性が強かったりすることから、必ずしも満足すべき防除薬剤とは言い難いものが少なくない。従って、かかる欠点の少ない安全に使用できる薬剤の開発が要望されている。

【0003】

本発明化合物と類似した骨格を有する化合物が、特許文献1に抗ウイルス剤として記載されているが、殺ダニ活性を有する旨は記載されてなく、本発明化合物の合成および生物活性についてはこれまで報告されていなかった。

【特許文献1】欧州特許出願公報第0605031号明細書

【発明の開示】

【発明が解決しようとする課題】

【0004】

本発明は、工業的に有利に合成でき効果が確実で安全に使用できる有害生物防除剤となりうる新規化合物を提供することを課題とする。

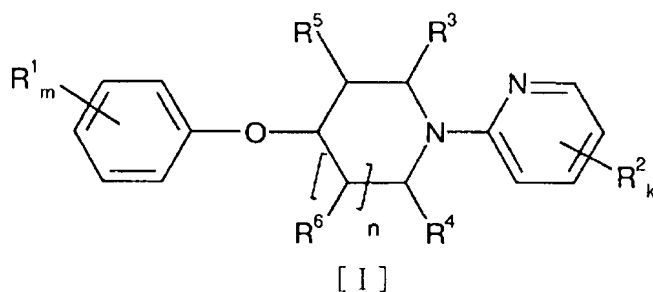
【課題を解決するための手段】

【0005】

本発明は、式[1]

【0006】

【化1】



【0007】

【式中、 R^1 は、ヒドロキシ基、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、ホルミル基、 G^1 で置換されても良い C_{1-6} アルキル基、 C_{1-6} ハロアルキル基、 C_{2-6} アルケニル基、 C_{2-6} アルキニル基、 C_{1-6} アルキルカルボニル基、 G^2 で置換されていても良い C_{1-6} アルコキシ基、 C_{1-6} ハロアルコキシ基、 C_{2-6} アルケニルオキシ基、 C_{2-6} ジハロアルケニルオキシ基、 C_{2-6} アルキニルオキシ基、 C_{4-6} アレニルオキシ基、ベンジルオキシ基、ベンゾイルオキシ基、ナフチルメチルオキシ基、 C_{1-6} アルコキシカルボニル基、 C_{1-6} アルキルカルボニルオキシ基、 C_{1-6} アルコキシカルボニルオキシ基、 C_{1-6} アルキルチオカルボニルオキシ基、 G^3 で置換されても良いアミノ基、 C_{1-6} アルキルチオ基、 C_{1-6} ハロアルキルチオ基、 C_{1-6} アルキルスルフィニル基、 C_{1-6} ハロアルキルスルフィニル基、 C_{1-6} アルキルスルホニル基、 C_{1-6} ハロアルキルスルホニル基、 C_{1-6} アルキルスルホニルオキシ

基、または C_{1-6} ハロアルキルスルホニルオキシ基を表し、 m は0または1～5の整数を表す。

R^2 は、ハロゲン原子、ニトロ基、 C_{1-6} アルキル基、 C_{1-6} アルコキシ基、 C_{1-6} ハロアルキル基、または C_{1-6} ハロアルコキシ基を表し、 k は1～4の整数を表す。

R^3 、 R^4 、 R^5 および R^6 は、それぞれ独立して、水素原子、または C_{1-6} アルキル基を表し、これらは一緒になって飽和環を形成し、全体として橋かけ環を形成してもよい。

$n=0$ または1を表す。

G^1 は、ヒドロキシル基、ハロゲン原子、カルボニル基、または G^2 で置換されていても良い C_{1-6} アルコキシ基を表し、 G^1 は同一または複数個置換していてもよい。

G^2 は、ヒドロキシル基、 C_{1-6} アルコキシ基、 C_{1-6} アルコキシ C_{1-6} アルコキシ基を表す。

G^3 は、 C_{1-6} アルキル基、ジ C_{1-6} アルキル基、 C_{1-6} アルキルカルボニル基、 C_{1-6} アルキルスルホニル基、ジ C_{1-6} アルキルスルホニル基、 C_{1-6} ハロアルキルスルホニル基、またはジ C_{1-6} ハロアルキルスルホニル基を表す。]

で表される化合物、および $k=0$ の場合を含む該化合物またはその塩を有効成分として含有してなる有害生物防除剤である。

【発明を実施するための最良の形態】

【0008】

前記式【1】において、

R^1 は、ヒドロキシル基；

フッ素、塩素、臭素、ヨウ素等のハロゲン原子；

シアノ基；

ニトロ基；

ホルミル基；

G^1 で置換されても良い（メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、sec-ブチル、イソブチル、t-ブチル、ペンチルおよびその異性体、ヘキシルおよびその異性体等）の C_{1-6} アルキル基；

クロロメチル、フルオロメチル、プロモメチル、ジクロロメチル、ジフルオロメチル、ジプロモメチル、トリクロロメチル、トリフルオロメチル、トルフルオロエチル、ペンタフルオロエチル等の C_{1-6} ハロアルキル基；

エテニル、1-プロペニル、2-プロペニル、1-ブテニル、2-ブテニル、3-ブテニル、1-メチル-2-プロペニル、2-メチル-2-プロペニル、1-ペンテニル、2-ペンテニル、3-ペンテニル、4-ペンテニル、1-メチル-2-ブテニル、2-メチル-2-ブテニル、1-ヘキセニル、2-ヘキセニル、3-ヘキセニル、4-ヘキセニル、5-ヘキセニル等の C_{2-6} アルケニル基；

プロパルギル、2-ブチニル等の C_{2-6} アルキニル基；

アセチル、プロピオニル等の C_{1-6} アルキルカルボニル基；

G^2 で置換されていても良い（メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、n-ブトキシ、sec-ブトキシ、イソブトキシ、t-ブトキシ、n-ヘキシル、シクロプロピルメトキシ等）の C_{1-6} アルコキシ基；

クロロメトキシ、ジクロロメトキシ、トリクロロメトキシ、トリフルオロメトキシ、プロモジフルオロメチル基、1-フルオロエトキシ、1, 1-ジフルオロエトキシ等の C_{1-6} ハロアルコキシ基；

ビニルオキシ、アリルオキシ、ブテニルオキシ等の C_{2-6} アルケニルオキシ基；

1, 1-ジクロロプロペニルオキシ等の C_{2-6} ジハロアルケニルオキシ基；

エチニルオキシ、プロパルギルオキシ等の C_{2-6} アルキニルオキシ基；

アレニルオキシ等の C_{4-6} アレニルオキシ基；

ベンジルオキシ等のベンジルオキシ基；

ベンゾイルオキシ等のベンゾイルオキシ基；

ナフチルメチルオキシ等のナフチルメチルオキシ基；

メトキシカルボニル、エトキシカルボニル等の C_{1-6} アルコキシカルボニル基；
アセチルオキシ等の C_{1-6} アルキルカルボニルオキシ基；
メトキシカルボニルオキシ等の C_{1-6} アルコキシカルボニルオキシ基；
メチルチオカルボニルオキシ等の C_{1-6} アルキルチオカルボニルオキシ基；
 G^2 で置換されても良いアミノ基；
メチルチオ等の C_{1-6} アルキルチオ基；
トリフルオロメチルチオ等の C_{1-6} ハロアルキルチオ基；
メチルスルフィニル等の C_{1-6} アルキルスルフィニル基；
トリフルオロメチルスルフィニル等の C_{1-6} ハロアルキルスルフィニル基；
メチルスルホニル等の C_{1-6} アルキルスルホニル基；
トリフルオロメチルスルホニル等の C_{1-6} ハロアルキルスルホニル基；
メチルスルホニルオキシ等の C_{1-6} アルキルスルホニルオキシ基；
トリフルオロメチルスルホニルオキシ等の C_{1-6} ハロアルキルスルホニルオキシ基を表す。

R^2 は、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素等のハロゲン原子；
ニトロ基；

メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、sec-ブチル、イソブチル、t-ブチル、ペンチルおよびその異性体、ヘキシルおよびその異性体等の C_{1-6} アルキル基；
メトキシ、エトキシ、プロボキシ、イソプロボキシ、ブトキシ、sec-ブトキシ、イソブトキシ、t-ブトキシ等の C_{1-6} アルコキシ基；
クロロメチル、フルオロメチル、プロモメチル、ジクロロメチル、ジフルオロメチル、ジプロモメチル、トリクロロメチル、トリフルオロメチル、トルフルオロエチル、ペンタフルオロエチル等の C_{1-6} ハロアルキル基；

クロロメトキシ、ジクロロメトキシ、トリクロロメトキシ、トリフルオロメトキシ、1-フルオロエトキシ、1, 1-ジフルオロエトキシ等の C_{1-6} ハロアルコキシ基を表す。

R^3 、 R^4 、 R^5 および R^6 は、それぞれ独立して水素原子、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、sec-ブチル、イソブチル、t-ブチル、ペンチルおよびその異性体、ヘキシルおよびその異性体等の C_{1-6} アルキル基を表す。 R^3 と R^4 または R^5 と R^6 は、一緒になって、飽和環を形成し、全体として、例えば、8-アザビシクロ[3.2.1]オクタン等の橋かけ環を形成してもよい。

G^1 は、ヒドロキシル基；

フッ素、塩素、臭素、ヨウ素等のハロゲン原子；

カルボニル基；

G^2 で置換されていても良い（メトキシ、エトキシ、プロボキシ、イソプロボキシ、ブトキシ、sec-ブトキシ、イソブトキシ、t-ブトキシ等）の C_{1-6} アルコキシ基を表す。

G^2 は、メトキシ、エトキシ、プロボキシ、イソプロボキシ、ブトキシ、sec-ブトキシ、イソブトキシ、t-ブトキシ等の C_{1-6} アルコキシ

メトキシメトキシ、メトキシエトキシ、エトキシメトキシ等の C_{1-6} アルコキシ C_{1-6} アルコキシ基を表す。

G^3 は、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、sec-ブチル、イソブチル、t-ブチル、ペンチルおよびその異性体、ヘキシルおよびその異性体等の C_{1-6} アルキル基；

ジメチル、ジエチル等のジ C_{1-6} アルキル基；

アセチル等の C_{1-6} アルキルカルボニル基、メチルスルホニル等の C_{1-6} アルキルスルホニル基；

ジメチルスルホニル等のジ C_{1-6} アルキルスルホニル基；

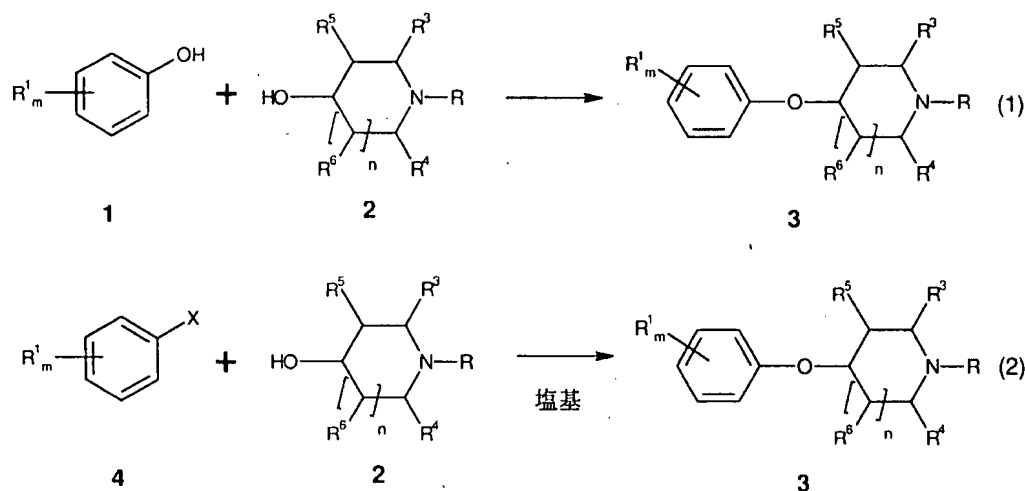
トリフルオロメチルスルホニル等の C_{1-6} ハロアルキルスルホニル基；

ビス（トリフルオロメチルスルホニル）等のジ C_{1-6} ハロアルキルスルホニル基を表す。

本発明化合物の製造法について、以下説明する。

【0010】

【化2】



【0011】

【式中、 $R^1 \sim R^6$ 、および n は前記と同じ意味を表し、 X は、脱離基を表す。また、 R は、 R^2 で置換された 2-ピリジル基、メチル基、ベンジル基、ベンジルオキシカルボニル基のいずれかを表す。】

【0012】

まず、中間体 3 の合成について説明する。

式 (1) に示すとおり、フェノール 1 と化合物 2 との形式的な脱水反応、例えば、光延反応により、中間体 3 を合成することができる。その具体的な方法については、Tetrahedron Lett., 1973, 2243; J. Org. Chem., 50, 3095 (1985) 等に記載されている。なお、フェノール 1 の製造法については、"The Chemistry of Phenols," Eds. Z. Rappoport, J. Wiley (2003), Part I, pp395 等に記載されている。

【0013】

また、式 (2) に示すとおり、アリアルハライド 4 と化合物 2 とのカップリングによっても中間体 3 を合成することができる。その具体的な方法については、Synth. Commun., 1984, 14, 621; J. Org. Chem., 48, 3771 (1983); J. Med. Chem., 17, 1000 (1974) 等に記載されている。

【0014】

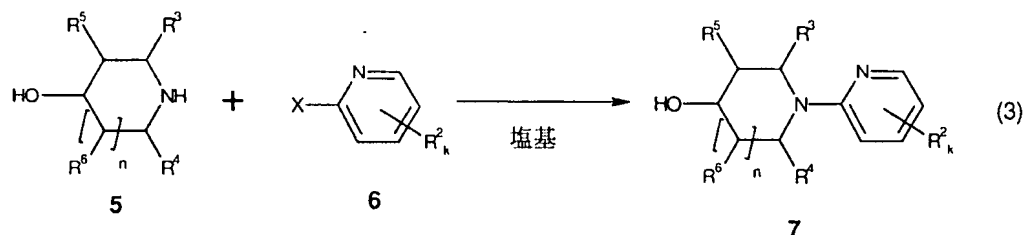
この際、使用できる塩基としては、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の炭酸塩、ナトリウムメトキシド、カリウム *t*-ブトキシド、マグネシウムエトキシド等の金属アルコキシド、*n*-ブチルリチウム、LDA 等の有機金属、水素化ナトリウム、水素化カリウム等の金属水素化物、トリエチルアミン、ジイソプロピルアミン、ピリジン等の有機塩基等が挙げられる。本反応は溶媒存在下または無溶媒で行うことができる。使用できる溶媒としては、反応に不活性な溶媒であれば特に限定されず、例えばペンタン、ヘキサン、ヘプタン、ベンゼン、トルエン、キシレン等の炭化水素系溶媒、ジクロロメタン、1, 2-ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン系溶媒、アセトニトリル、プロピオンニトリル等のニトリル系溶媒、ジエチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン等のエーテル系溶媒、*N,N*-ジメチルホルムアミド (DMF)、ジメチルスルホキシド (DMSO) 等の非プロトン性極性溶媒、およびこれらの溶媒を二つ以上混合した混合溶媒系が挙げられる。反応温度は -78°C から用いる溶媒の沸点までの温度範囲から任意の温度で反応させることができる。

【0015】

従って、化合物 2 において、R が、 R^2 で置換された 2-ピリジル基の場合（化合物 7）、式（1）または式（2）により、直接的に、本発明化合物 [I] を合成できる。
 なお、化合物 7 は、式（3）に示すとおり、アミン 5 と 2-ハロピリジン 6 とのカップリングによって合成することができる。その具体的な方法は、Synthesis, 1981, 606 ; J. Chem. Soc., C, 3693 (1971) 等に記載されている。

【0016】

【化 3】



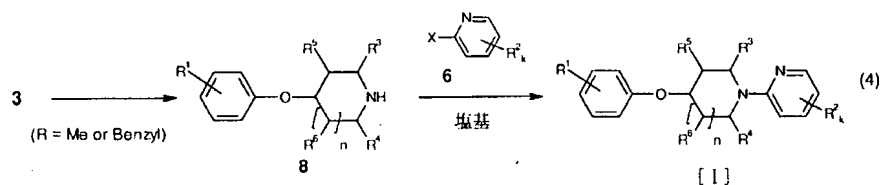
【0017】

一方、化合物 2 において、R が、メチル基、ベンジル基またはベンジルオキシカルボニル基の場合は、式（1）または式（2）により得られた中間体 3 から、脱メチル化、脱ベンジル化または脱ベンジルオキシカルボニル化を行う必要がある。

脱メチル化の具体的な方法は、Tetrahedron Lett., 1974, 1325 ; *ibid.*, 1977, 1565 ; *ibid.*, 1995, 8367 等に記載されている。また、脱ベンジル化、脱ベンジルオキシカルボニル化は、通常の接触水素還元などを用いることができる。こうして、式（4）に示すように、中間体 3 から、中間体 8 を得、次いで、2-ハロピリジン 6 とのカップリングによって、本発明化合物 [I] を合成できる。このカップリングの具体的な方法は、式（3）と同様である。

【0018】

【化 4】

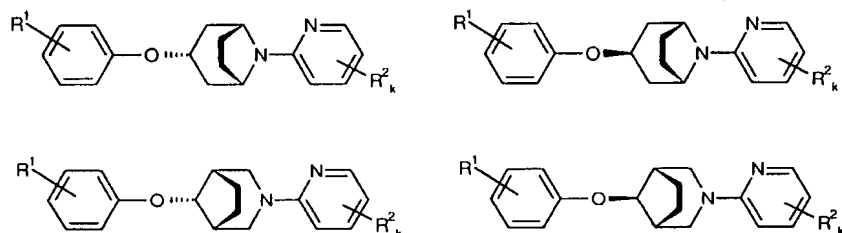


なお、化合物 2（R が、メチル基、ベンジル基またはベンジルオキシカルボニル）は、入手可能であれば市販品をそのまま使用できる。

また、中間体 8 は、アミンとして単独で、または、塩酸や酢酸などと塩を形成して存在してもよい。なお、本発明化合物 [I] の R^3 と R^4 とが、または R^5 と R^6 とが一緒になって飽和環を形成する場合、以下に示すような 2 種ずつの異性体が存在する。これらの異性体は全て本発明に含まれる。

【0019】

【化 5】

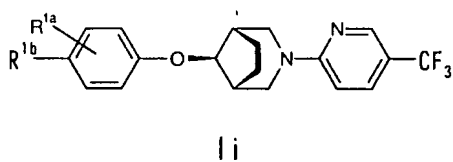
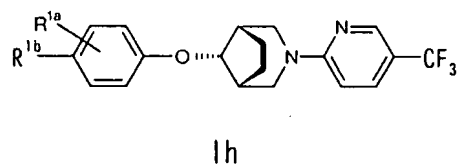
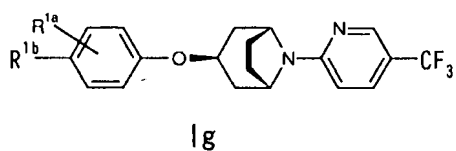
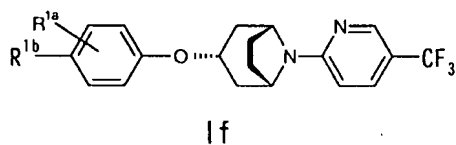
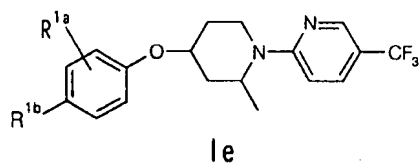
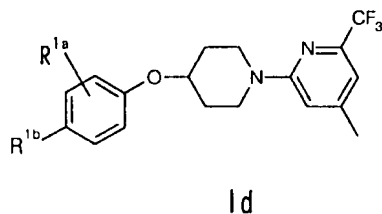
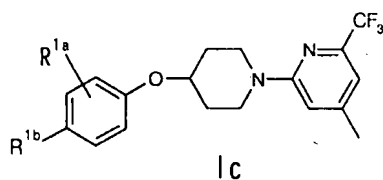
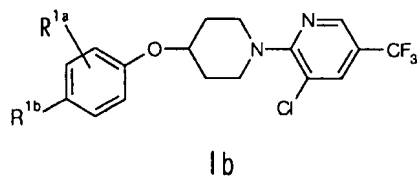
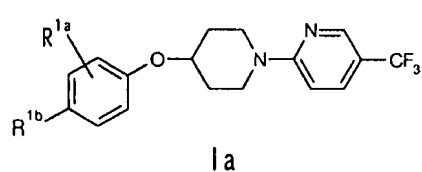


【0020】

以上のようにして製造することのできる本発明化合物の代表例を以下に示す。

【0021】

【化6】



【0022】

以下の表に上記化合物 Ia から Ii までの R^{1a}、R^{1b} の組み合わせを例示する
 なお、表中の略称は以下の意味を示す。

Me : メチル、Et : エチル、Pr : プロピル、Bu : ブチル、Pen : ペンチル、Ph : フェニル、Hex : ヘキシル、n : ノルマル、i : イソ、t : ターシャリー、c : シクロ、Naph : ナフチル、Ac : アセチル

【0023】

【表1】

第1表

R1a	R1b	R1a	R1b	R1a	R1b
H	H	H	2-NH ⁿ Pr	F	2-OCH ₂ ^c Pr
H	2-OH	H	2-N(Ac) ⁿ Pr	F	2-OCH ₂ CH=CCl ₂
H	2-Me	H	2-NH ₂ -6-Cl	F	2-OCH ₂ ^t Bu
H	1,6-Me ₃	H	2-CH ₂ OMe	F	2-O(CH ₂) ₂ OH
H	2-Et	H	2-CH ₂ OEt	F	2-O(CH ₂) ₂ OMe
H	2-allyl	H	2-CH ₂ ^t Bu	F	2-O(CH ₂) ₂ OCH ₂ OMe
H	2- ⁱ Pr	H	2-CH ₂ OCH ₂ OMe	F	2-O(CH ₂) ₂ Cl
H	2- ⁿ Pr	H	2-CH(OH)Et	F	2-O(CH ₂) ₂ Br
H	2-F	H	2-CH ₂ OH	F	2-OC(O)Me
H	2-Cl	H	2-CH ₂ Cl	F	2-C(O)Et
H	2-Br	H	2-CH=CHMe	F	2-OC(O)SMe
H	2-I	H	2-CH(Cl)Et	F	2-CN
H	2,6-Cl ₂	H	2-CH ₂ OCH ₂ OMe	F	2-CHO
H	2,3,6-Cl ₃	H	2-CH ₂ OCH ₂ OEt	F	2-NO ₂
H	2-Br-6-Cl	H	2-Cl-6-NO ₂	F	2-NH ₂
H	2-CF ₃	H	2-Cl-6-O ⁿ Pr	F	2-NHEt
H	3-CF ₃	H	2-Cl-6-O ⁱ Pr	F	2-N(ⁿ Pr) ₂
H	3,5-CF ₃	F	H	F	2-NH ⁿ Pr
H	2-OMe	F	2-OH	F	2-N(Ac) ⁿ Pr
H	2-OEt	F	2-Me	F	2-NH ₂ -6-Cl
H	2-O ⁱ Pr	F	1,6-Me ₃	F	2-CH ₂ OMe
H	2-O ⁿ Pr	F	2-Et	F	2-CH ₂ OEt
H	2-O ⁿ Bu	F	2-allyl	F	2-CH ₂ ^t Bu
H	2-O ⁱ Bu	F	2- ⁱ Pr	F	2-CH ₂ OCH ₂ OMe
H	2-OMe	F	2- ⁿ Pr	F	2-CH(OH)Et
H	2-OAc	F	2-F	F	2-CH ₂ OH
H	2-Oallyl	F	2-Cl	F	2-CH ₂ Cl
H	2-Oallenyl	F	2-Br	F	2-CH=CHMe
H	2-Opropargyl	F	2-I	F	2-CH(Cl)Et
H	2-OCH ₂ ^c Pr	F	2,6-Cl ₂	F	2-CH ₂ OCH ₂ OMe
H	2-OCH ₂ CH=CCl ₂	F	2,3,6-Cl ₃	F	2-CH ₂ OCH ₂ OEt
H	2-OCH ₂ ^t Bu	F	2-Br-6-Cl	F	2-Cl-6-NO ₂
H	2-O(CH ₂) ₂ OH	F	2-CF ₃	F	2-Cl-6-O ⁿ Pr
H	2-O(CH ₂) ₂ OMe	F	3-CF ₃	F	2-Cl-6-O ⁱ Pr
H	2-O(CH ₂) ₂ OCH ₂ OMe	F	3,5-CF ₃		
H	2-O(CH ₂) ₂ Cl	F	2-OMe		
H	2-O(CH ₂) ₂ Br	F	2-OEt		
H	2-OC(O)Me	F	2-O ⁱ Pr		
H	2-C(O)Et	F	2-O ⁿ Pr		
H	2-OC(O)SMe	F	2-O ⁿ Bu		
H	2-CN	F	2-O ⁱ Bu		
H	2-CHO	F	2-OMe		
H	2-NO ₂	F	2-OAc		
H	2-NH ₂	F	2-Oallyl		
H	2-NHEt	F	2-Oallenyl		
H	2-N(ⁿ Pr) ₂	F	2-Opropargyl		

【0024】

【表 2】

第1表つづき

R1a	R1b	R1a	R1b	R1a	R1b
CF3	H	CF3	2-NH ⁿ Pr	OH	2-OCH2 ^c Pr
CF3	2-OH	CF3	2-N(Ac) ⁿ Pr	OH	2-OCH2CH=CCl2
CF3	2-Me	CF3	2-NH2-6-Cl	OH	2-OCH2 ¹ Bu
CF3	1,6-Me3	CF3	2-CH2OMe	OH	2-O(CH2)2OH
CF3	2-Et	CF3	2-CH2OEt	OH	2-O(CH2)2OMe
CF3	2-allyl	CF3	2-CH2 ¹ Bu	OH	2-O(CH2)2OCH2OMe
CF3	2- ⁱ Pr	CF3	2-CH2OCH2OMe	OH	2-O(CH2)2Cl
CF3	2- ⁿ Pr	CF3	2-CH(OH)Et	OH	2-O(CH2)2Br
CF3	2-F	CF3	2-CH2OH	OH	2-OC(O)Me
CF3	2-Cl	CF3	2-CH2Cl	OH	2-C(O)Et
CF3	2-Br	CF3	2-CH=CHMe	OH	2-OC(O)SMe
CF3	2-I	CF3	2-CH(Cl)Et	OH	2-CN
CF3	2,6-Cl2	CF3	2-CH2OCH2OMe	OH	2-CHO
CF3	2,3,6-Cl3	CF3	2-CH2OCH2OEt	OH	2-NO2
CF3	2-Br-6-Cl	CF3	2-Cl-6-NO2	OH	2-NH2
CF3	2-CF3	CF3	2-Cl-6-O ⁿ Pr	OH	2-NHEt
CF3	3-CF3	CF3	2-Cl-6-O ⁱ Pr	OH	2-N(ⁿ Pr)2
CF3	3,5-CF3	OH	H	OH	2-NH ⁿ Pr
CF3	2-OMe	OH	2-OH	OH	2-N(Ac) ⁿ Pr
CF3	2-OEt	OH	2-Me	OH	2-NH2-6-Cl
CF3	2-O ⁱ Pr	OH	1,6-Me3	OH	2-CH2OMe
CF3	2-O ⁿ Pr	OH	2-Et	OH	2-CH2OEt
CF3	2-O ⁿ Bu	OH	2-allyl	OH	2-CH2 ¹ Bu
CF3	2-O ⁱ Bu	OH	2- ⁱ Pr	OH	2-CH2OCH2OMe
CF3	2-OHex	OH	2- ⁿ Pr	OH	2-CH(OH)Et
CF3	2-OAc	OH	2-F	OH	2-CH2OH
CF3	2-Oallyl	OH	2-Cl	OH	2-CH2Cl
CF3	2-Oallenyl	OH	2-Br	OH	2-CH=CHMe
CF3	2-Opropargyl	OH	2-I	OH	2-CH(Cl)Et
CF3	2-OCH2 ^c Pr	OH	2,6-Cl2	OH	2-CH2OCH2OMe
CF3	2-OCH2CH=CCl2	OH	2,3,6-Cl3	OH	2-CH2OCH2OEt
CF3	2-OCH2 ¹ Bu	OH	2-Br-6-Cl	OH	2-Cl-6-NO2
CF3	2-O(CH2)2OH	OH	2-CF3	OH	2-Cl-6-O ⁿ Pr
CF3	2-O(CH2)2OMe	OH	3-CF3	OH	2-Cl-6-O ⁱ Pr
CF3	2-O(CH2)2OCH2OMe	OH	3,5-CF3		
CF3	2-O(CH2)2Cl	OH	2-OMe		
CF3	2-O(CH2)2Br	OH	2-OEt		
CF3	2-OC(O)Me	OH	2-O ⁱ Pr		
CF3	2-C(O)Et	OH	2-O ⁿ Pr		
CF3	2-OC(O)SMe	OH	2-O ⁿ Bu		
CF3	2-CN	OH	2-O ⁱ Bu		
CF3	2-CHO	OH	2-OHex		
CF3	2-NO2	OH	2-OAc		
CF3	2-NH2	OH	2-Oallyl		
CF3	2-NHEt	OH	2-Oallenyl		
CF3	2-N(ⁿ Pr)2	OH	2-Opropargyl		

【表 3】

第1表つぎ

R1a	R1b	R1a	R1b	R1a	R1b
Cl	H	Cl	2-NH ⁿ Pr	Br	2-OCH ₂ ^c Pr
Cl	2-OH	Cl	2-N(Ac) ⁿ Pr	Br	2-OCH ₂ CH=CCl ₂
Cl	2-Me	Cl	2-NH ₂ -6-Cl	Br	2-OCH ₂ ^t Bu
Cl	1,6-Me ₃	Cl	2-CH ₂ OMe	Br	2-O(CH ₂) ₂ OH
Cl	2-Et	Cl	2-CH ₂ OE _t	Br	2-O(CH ₂) ₂ OMe
Cl	2-allyl	Cl	2-CH ₂ ^t Bu	Br	2-O(CH ₂) ₂ OCH ₂ OMe
Cl	2- ⁱ Pr	Cl	2-CH ₂ OCH ₂ OMe	Br	2-O(CH ₂) ₂ Cl
Cl	2- ⁿ Pr	Cl	2-CH(OH)Et	Br	2-O(CH ₂) ₂ Br
Cl	2-F	Cl	2-CH ₂ OH	Br	2-OC(O)Me
Cl	2-Cl	Cl	2-CH ₂ Cl	Br	2-C(O)Et
Cl	2-Br	Cl	2-CH=CHMe	Br	2-OC(O)SMe
Cl	2-I	Cl	2-CH(Cl)Et	Br	2-CN
Cl	2,6-Cl ₂	Cl	2-CH ₂ OCH ₂ OMe	Br	2-CHO
Cl	2,3,6-Cl ₃	Cl	2-CH ₂ OCH ₂ OE _t	Br	2-NO ₂
Cl	2-Br-6-Cl	Cl	2-Cl-6-NO ₂	Br	2-NH ₂
Cl	2-CF ₃	Cl	2-Cl-6-O ⁿ Pr	Br	2-NHE _t
Cl	3-CF ₃	Cl	2-Cl-6-O ⁱ Pr	Br	2-N(ⁿ Pr) ₂
Cl	3,5-CF ₃	Br	H	Br	2-NH ⁿ Pr
Cl	2-OMe	Br	2-OH	Br	2-N(Ac) ⁿ Pr
Cl	2-OEt	Br	2-Me	Br	2-NH ₂ -6-Cl
Cl	2-O ⁱ Pr	Br	1,6-Me ₃	Br	2-CH ₂ OMe
Cl	2-O ⁿ Pr	Br	2-Et	Br	2-CH ₂ OE _t
Cl	2-O ⁿ Bu	Br	2-allyl	Br	2-CH ₂ ^t Bu
Cl	2-O ⁱ Bu	Br	2- ⁱ Pr	Br	2-CH ₂ OCH ₂ OMe
Cl	2-OHex	Br	2- ⁿ Pr	Br	2-CH(OH)Et
Cl	2-OAc	Br	2-F	Br	2-CH ₂ OH
Cl	2-Oallyl	Br	2-Cl	Br	2-CH ₂ Cl
Cl	2-Oallenyl	Br	2-Br	Br	2-CH=CHMe
Cl	2-Opropargyl	Br	2-I	Br	2-CH(Cl)Et
Cl	2-OCH ₂ ^c Pr	Br	2,6-Cl ₂	Br	2-CH ₂ OCH ₂ OMe
Cl	2-OCH ₂ CH=CCl ₂	Br	2,3,6-Cl ₃	Br	2-CH ₂ OCH ₂ OE _t
Cl	2-OCH ₂ ^t Bu	Br	2-Br-6-Cl	Br	2-Cl-6-NO ₂
Cl	2-O(CH ₂) ₂ OH	Br	2-CF ₃	Br	2-Cl-6-O ⁿ Pr
Cl	2-O(CH ₂) ₂ OMe	Br	3-CF ₃	Br	2-Cl-6-O ⁱ Pr
Cl	2-O(CH ₂) ₂ OCH ₂ OMe	Br	3,5-CF ₃		
Cl	2-O(CH ₂) ₂ Cl	Br	2-OMe		
Cl	2-O(CH ₂) ₂ Br	Br	2-OEt		
Cl	2-OC(O)Me	Br	2-O ⁱ Pr		
Cl	2-C(O)Et	Br	2-O ⁿ Pr		
Cl	2-OC(O)SMe	Br	2-O ⁿ Bu		
Cl	2-CN	Br	2-O ⁱ Bu		
Cl	2-CHO	Br	2-OHex		
Cl	2-NO ₂	Br	2-OAc		
Cl	2-NH ₂	Br	2-Oallyl		
Cl	2-NHE _t	Br	2-Oallenyl		
Cl	2-N(ⁿ Pr) ₂	Br	2-Opropargyl		

【 0 0 2 6 】

【表4】

第1表つづき

R1a	R1b	R1a	R1b	R1a	R1b
Me	H	Me	2-NH ⁿ Pr	NO2	2-OCH2 ^c Pr
Me	2-OH	Me	2-N(Ac) ⁿ Pr	NO2	2-OCH2CH=CCl2
Me	2-Me	Me	2-NH2-6-Cl	NO2	2-OCH2 ⁱ Bu
Me	1,6-Me3	Me	2-CH2OMe	NO2	2-O(CH2)2OH
Me	2-Et	Me	2-CH2OEt	NO2	2-O(CH2)2OMe
Me	2-allyl	Me	2-CH2 ⁱ Bu	NO2	2-O(CH2)2OCH2OMe
Me	2- ⁱ Pr	Me	2-CH2OCH2OMe	NO2	2-O(CH2)2Cl
Me	2- ⁿ Pr	Me	2-CH(OH)Et	NO2	2-O(CH2)2Br
Me	2-F	Me	2-CH2OH	NO2	2-OC(O)Me
Me	2-Cl	Me	2-CH2Cl	NO2	2-C(O)Et
Me	2-Br	Me	2-CH=CHMe	NO2	2-OC(O)SMe
Me	2-I	Me	2-CH(Cl)Et	NO2	2-CN
Me	2,6-Cl2	Me	2-CH2OCH2OMe	NO2	2-CHO
Me	2,3,6-Cl3	Me	2-CH2OCH2OEt	NO2	2-NO2
Me	2-Br-6-Cl	Me	2-Cl-6-NO2	NO2	2-NH2
Me	2-CF3	Me	2-Cl-6-O ⁿ Pr	NO2	2-NHEt
Me	3-CF3	Me	2-Cl-6-O ⁱ Pr	NO2	2-N(ⁿ Pr)2
Me	3,5-CF3	NO2	H	NO2	2-NH ⁿ Pr
Me	2-OMe	NO2	2-OH	NO2	2-N(Ac) ⁿ Pr
Me	2-OEt	NO2	2-Me	NO2	2-NH2-6-Cl
Me	2-O ⁱ Pr	NO2	1,6-Me3	NO2	2-CH2OMe
Me	2-O ⁿ Pr	NO2	2-Et	NO2	2-CH2OEt
Me	2-O ⁿ Bu	NO2	2-allyl	NO2	2-CH2 ⁱ Bu
Me	2-O ⁱ Bu	NO2	2- ⁱ Pr	NO2	2-CH2OCH2OMe
Me	2-CHex	NO2	2- ⁿ Pr	NO2	2-CH(OH)Et
Me	2-OAc	NO2	2-F	NO2	2-CH2OH
Me	2-Oallyl	NO2	2-Cl	NO2	2-CH2Cl
Me	2-Oallenyl	NO2	2-Br	NO2	2-CH=CHMe
Me	2-Opropargyl	NO2	2-I	NO2	2-CH(Cl)Et
Me	2-OCH2 ^c Pr	NO2	2,6-Cl2	NO2	2-CH2OCH2OMe
Me	2-OCH2CH=CCl2	NO2	2,3,6-Cl3	NO2	2-CH2OCH2OEt
Me	2-OCH2 ⁱ Bu	NO2	2-Br-6-Cl	NO2	2-Cl-6-NO2
Me	2-O(CH2)2OH	NO2	2-CF3	NO2	2-Cl-6-O ⁿ Pr
Me	2-O(CH2)2OMe	NO2	3-CF3	NO2	2-Cl-6-O ⁱ Pr
Me	2-O(CH2)2OCH2OMe	NO2	3,5-CF3		
Me	2-O(CH2)2Cl	NO2	2-OMe		
Me	2-O(CH2)2Br	NO2	2-OEt		
Me	2-OC(O)Me	NO2	2-O ⁱ Pr		
Me	2-C(O)Et	NO2	2-O ⁿ Pr		
Me	2-OC(O)SMe	NO2	2-O ⁿ Bu		
Me	2-CN	NO2	2-O ⁱ Bu		
Me	2-CHO	NO2	2-CHex		
Me	2-NO2	NO2	2-OAc		
Me	2-NH2	NO2	2-Oallyl		
Me	2-NHEt	NO2	2-Oallenyl		
Me	2-N(ⁿ Pr)2	NO2	2-Opropargyl		

【表5】

第1表つづき

R1a	R1b	R1a	R1b	R1a	R1b
CO2Me	H	CO2Me	2-NH ⁿ Pr	OCH2CH=CCl2	2-OCH2 ^c Pr
CO2Me	2-OH	CO2Me	2-N(Ac) ⁿ Pr	OCH2CH=CCl2	2-OCH2CH=CCl2
CO2Me	2-Me	CO2Me	2-NH2-6-Cl	OCH2CH=CCl2	2-OCH2 ⁱ Bu
CO2Me	1,6-Me3	CO2Me	2-CH2OMe	OCH2CH=CCl2	2-O(CH2)2OH
CO2Me	2-Et	CO2Me	2-CH2OEt	OCH2CH=CCl2	2-O(CH2)2OMe
CO2Me	2-allyl	CO2Me	2-CH2 ⁱ Bu	OCH2CH=CCl2	2-O(CH2)2OCH2OMe
CO2Me	2- ⁱ Pr	CO2Me	2-CH2OCH2OMe	OCH2CH=CCl2	2-O(CH2)2Cl
CO2Me	2- ⁿ Pr	CO2Me	2-CH(OH)Et	OCH2CH=CCl2	2-O(CH2)2Br
CO2Me	2-F	CO2Me	2-CH2OH	OCH2CH=CCl2	2-OC(O)Me
CO2Me	2-Cl	CO2Me	2-CH2Cl	OCH2CH=CCl2	2-C(O)Et
CO2Me	2-Br	CO2Me	2-CH=CHMe	OCH2CH=CCl2	2-OC(O)SMe
CO2Me	2-I	CO2Me	2-CH(Cl)Et	OCH2CH=CCl2	2-CN
CO2Me	2,6-Cl2	CO2Me	2-CH2OCH2OMe	OCH2CH=CCl2	2-CHO
CO2Me	2,3,6-Cl3	CO2Me	2-CH2OCH2OEt	OCH2CH=CCl2	2-NO2
CO2Me	2-Br-6-Cl	CO2Me	2-Cl-6-NO2	OCH2CH=CCl2	2-NH2
CO2Me	2-CF3	CO2Me	2-Cl-6-O ⁿ Pr	OCH2CH=CCl2	2-NHEt
CO2Me	3-CF3	CO2Me	2-Cl-6-O ⁱ Pr	OCH2CH=CCl2	2-N(ⁿ Pr)2
CO2Me	3,5-CF3	OCH2CH=CCl2	H	OCH2CH=CCl2	2-NH ⁿ Pr
CO2Me	2-OMe	OCH2CH=CCl2	2-OH	OCH2CH=CCl2	2-N(Ac) ⁿ Pr
CO2Me	2-OEt	OCH2CH=CCl2	2-Me	OCH2CH=CCl2	2-NH2-6-Cl
CO2Me	2-O ⁱ Pr	OCH2CH=CCl2	1,6-Me3	OCH2CH=CCl2	2-CH2OMe
CO2Me	2-O ⁿ Pr	OCH2CH=CCl2	2-Et	OCH2CH=CCl2	2-CH2OEt
CO2Me	2-O ⁿ Bu	OCH2CH=CCl2	2-allyl	OCH2CH=CCl2	2-CH2 ⁱ Bu
CO2Me	2-O ⁱ Bu	OCH2CH=CCl2	2- ⁱ Pr	OCH2CH=CCl2	2-CH2OCH2OMe
CO2Me	2-OHex	OCH2CH=CCl2	2- ⁿ Pr	OCH2CH=CCl2	2-CH(OH)Et
CO2Me	2-OAc	OCH2CH=CCl2	2-F	OCH2CH=CCl2	2-CH2OH
CO2Me	2-Oallyl	OCH2CH=CCl2	2-Cl	OCH2CH=CCl2	2-CH2Cl
CO2Me	2-Oallenyl	OCH2CH=CCl2	2-Br	OCH2CH=CCl2	2-CH=CHMe
CO2Me	2-Opropargyl	OCH2CH=CCl2	2-I	OCH2CH=CCl2	2-CH(Cl)Et
CO2Me	2-OCH2 ^c Pr	OCH2CH=CCl2	2,6-Cl2	OCH2CH=CCl2	2-CH2OCH2OMe
CO2Me	2-OCH2CH=CCl2	OCH2CH=CCl2	2,3,6-Cl3	OCH2CH=CCl2	2-CH2OCH2OEt
CO2Me	2-OCH2 ⁱ Bu	OCH2CH=CCl2	2-Br-6-Cl	OCH2CH=CCl2	2-Cl-6-NO2
CO2Me	2-O(CH2)2OH	OCH2CH=CCl2	2-CF3	OCH2CH=CCl2	2-Cl-6-O ⁿ Pr
CO2Me	2-O(CH2)2OMe	OCH2CH=CCl2	3-CF3	OCH2CH=CCl2	2-Cl-6-O ⁱ Pr
CO2Me	2-O(CH2)2OCH2OMe	OCH2CH=CCl2	3,5-CF3		
CO2Me	2-O(CH2)2Cl	OCH2CH=CCl2	2-OMe		
CO2Me	2-O(CH2)2Br	OCH2CH=CCl2	2-OEt		
CO2Me	2-OC(O)Me	OCH2CH=CCl2	2-O ⁱ Pr		
CO2Me	2-C(O)Et	OCH2CH=CCl2	2-O ⁿ Pr		
CO2Me	2-OC(O)SMe	OCH2CH=CCl2	2-O ⁿ Bu		
CO2Me	2-CN	OCH2CH=CCl2	2-O ⁱ Bu		
CO2Me	2-CHO	OCH2CH=CCl2	2-OHex		
CO2Me	2-NO2	OCH2CH=CCl2	2-OAc		
CO2Me	2-NH2	OCH2CH=CCl2	2-Oallyl		
CO2Me	2-NHEt	OCH2CH=CCl2	2-Oallenyl		
CO2Me	2-N(ⁿ Pr)2	OCH2CH=CCl2	2-Opropargyl		

【表 6】

第1表つづき

R1a	R1b	R1a	R1b	R1a	R1b
CN	H	CN	2-NH ⁿ Pr	OMe	2-OCH ₂ ^c Pr
CN	2-OH	CN	2-N(Ac) ⁿ Pr	OMe	2-OCH ₂ CH=CCl ₂
CN	2-Me	CN	2-NH ₂ -6-Cl	OMe	2-OCH ₂ ^t Bu
CN	1,6-Me ₃	CN	2-CH ₂ OMe	OMe	2-O(CH ₂) ₂ OH
CN	2-Et	CN	2-CH ₂ OE _t	OMe	2-O(CH ₂) ₂ OMe
CN	2-allyl	CN	2-CH ₂ ^t Bu	OMe	2-O(CH ₂) ₂ OCH ₂ OMe
CN	2- ⁱ Pr	CN	2-CH ₂ OCH ₂ OMe	OMe	2-O(CH ₂) ₂ Cl
CN	2- ⁿ Pr	CN	2-CH(OH)Et	OMe	2-O(CH ₂) ₂ Br
CN	2-F	CN	2-CH ₂ OH	OMe	2-OC(O)Me
CN	2-Cl	CN	2-CH ₂ Cl	OMe	2-C(O)Et
CN	2-Br	CN	2-CH=CHMe	OMe	2-OC(O)SMe
CN	2-I	CN	2-CH(Cl)Et	OMe	2-CN
CN	2,6-Cl ₂	CN	2-CH ₂ OCH ₂ OMe	OMe	2-CHO
CN	2,3,6-Cl ₃	CN	2-CH ₂ OCH ₂ OE _t	OMe	2-NO ₂
CN	2-Br-6-Cl	CN	2-Cl-6-NO ₂	OMe	2-NH ₂
CN	2-CF ₃	CN	2-Cl-6-O ⁿ Pr	OMe	2-NHE _t
CN	3-CF ₃	CN	2-Cl-6-O ⁱ Pr	OMe	2-N(ⁿ Pr) ₂
CN	3,5-CF ₃	OMe	H	OMe	2-NH ⁿ Pr
CN	2-OMe	OMe	2-OH	OMe	2-N(Ac) ⁿ Pr
CN	2-OEt	OMe	2-Me	OMe	2-NH ₂ -6-Cl
CN	2-O ⁱ Pr	OMe	1,6-Me ₃	OMe	2-CH ₂ OMe
CN	2-O ⁿ Pr	OMe	2-Et	OMe	2-CH ₂ OE _t
CN	2-O ⁿ Bu	OMe	2-allyl	OMe	2-CH ₂ ^t Bu
CN	2-O ⁱ Bu	OMe	2- ⁱ Pr	OMe	2-CH ₂ OCH ₂ OMe
CN	2-CH ₂ OH	OMe	2- ⁿ Pr	OMe	2-CH(OH)Et
CN	2-OAc	OMe	2-F	OMe	2-CH ₂ OH
CN	2-Oallyl	OMe	2-Cl	OMe	2-CH ₂ Cl
CN	2-Oallenyl	OMe	2-Br	OMe	2-CH=CHMe
CN	2-Opropargyl	OMe	2-I	OMe	2-CH(Cl)Et
CN	2-OCH ₂ ^c Pr	OMe	2,6-Cl ₂	OMe	2-CH ₂ OCH ₂ OMe
CN	2-OCH ₂ CH=CCl ₂	OMe	2,3,6-Cl ₃	OMe	2-CH ₂ OCH ₂ OE _t
CN	2-OCH ₂ ^t Bu	OMe	2-Br-6-Cl	OMe	2-Cl-6-NO ₂
CN	2-O(CH ₂) ₂ OH	OMe	2-CF ₃	OMe	2-Cl-6-O ⁿ Pr
CN	2-O(CH ₂) ₂ OMe	OMe	3-CF ₃	OMe	2-Cl-6-O ⁱ Pr
CN	2-O(CH ₂) ₂ OCH ₂ OMe	OMe	3,5-CF ₃		
CN	2-O(CH ₂) ₂ Cl	OMe	2-OMe		
CN	2-O(CH ₂) ₂ Br	OMe	2-OEt		
CN	2-OC(O)Me	OMe	2-O ⁱ Pr		
CN	2-C(O)Et	OMe	2-O ⁿ Pr		
CN	2-OC(O)SMe	OMe	2-O ⁿ Bu		
CN	2-CN	OMe	2-O ⁱ Bu		
CN	2-CHO	OMe	2-CH ₂ OH		
CN	2-NO ₂	OMe	2-OAc		
CN	2-NH ₂	OMe	2-Oallyl		
CN	2-NHE _t	OMe	2-Oallenyl		
CN	2-N(ⁿ Pr) ₂	OMe	2-Opropargyl		

【表 7】

第1表つづき

R1a	R1b	R1a	R1b	R1a	R1b
OCF3	H	OCF3	2-NH ⁿ Pr	OCH2Br	2-OCH2 ^c Pr
OCF3	2-OH	OCF3	2-N(Ac) ⁿ Pr	OCH2Br	2-OCH2CH=CCl2
OCF3	2-Me	OCF3	2-NH2-6-Cl	OCH2Br	2-OCH2 ^t Bu
OCF3	1,6-Me3	OCF3	2-CH2OMe	OCH2Br	2-O(CH2)2OH
OCF3	2-Et	OCF3	2-CH2OEt	OCH2Br	2-O(CH2)2OMe
OCF3	2-allyl	OCF3	2-CH2 ^t Bu	OCH2Br	2-O(CH2)2OCH2OMe
OCF3	2- ⁱ Pr	OCF3	2-CH2OCH2OMe	OCH2Br	2-O(CH2)2Cl
OCF3	2- ⁿ Pr	OCF3	2-CH(OH)Et	OCH2Br	2-O(CH2)2Br
OCF3	2-F	OCF3	2-CH2OH	OCH2Br	2-OC(O)Me
OCF3	2-Cl	OCF3	2-CH2Cl	OCH2Br	2-C(O)Et
OCF3	2-Br	OCF3	2-CH=CHMe	OCH2Br	2-OC(O)SMe
OCF3	2-I	OCF3	2-CH(Cl)Et	OCH2Br	2-CN
OCF3	2,6-Cl2	OCF3	2-CH2OCH2OMe	OCH2Br	2-CHO
OCF3	2,3,6-Cl3	OCF3	2-CH2OCH2OEt	OCH2Br	2-NO2
OCF3	2-Br-6-Cl	OCF3	2-Cl-6-NO2	OCH2Br	2-NH2
OCF3	2-CF3	OCF3	2-Cl-6-O ⁿ Pr	OCH2Br	2-NHEt
OCF3	3-CF3	OCF3	2-Cl-6-O ⁱ Pr	OCH2Br	2-N(ⁿ Pr)2
OCF3	3,5-CF3	OCH2Br	H	OCH2Br	2-NH ⁿ Pr
OCF3	2-OMe	OCH2Br	2-OH	OCH2Br	2-N(Ac) ⁿ Pr
OCF3	2-OEt	OCH2Br	2-Me	OCH2Br	2-NH2-6-Cl
OCF3	2-O ⁱ Pr	OCH2Br	1,6-Me3	OCH2Br	2-CH2OMe
OCF3	2-O ⁿ Pr	OCH2Br	2-Et	OCH2Br	2-CH2OEt
OCF3	2-O ⁿ Bu	OCH2Br	2-allyl	OCH2Br	2-CH2 ^t Bu
OCF3	2-O ⁱ Bu	OCH2Br	2- ⁱ Pr	OCH2Br	2-CH2OCH2OMe
OCF3	2-OHex	OCH2Br	2- ⁿ Pr	OCH2Br	2-CH(OH)Et
OCF3	2-OAc	OCH2Br	2-F	OCH2Br	2-CH2OH
OCF3	2-Oallyl	OCH2Br	2-Cl	OCH2Br	2-CH2Cl
OCF3	2-Oallenyl	OCH2Br	2-Br	OCH2Br	2-CH=CHMe
OCF3	2-Opropargyl	OCH2Br	2-I	OCH2Br	2-CH(Cl)Et
OCF3	2-OCH2 ^c Pr	OCH2Br	2,6-Cl2	OCH2Br	2-CH2OCH2OMe
OCF3	2-OCH2CH=CCl2	OCH2Br	2,3,6-Cl3	OCH2Br	2-CH2OCH2OEt
OCF3	2-OCH2 ^t Bu	OCH2Br	2-Br-6-Cl	OCH2Br	2-Cl-6-NO2
OCF3	2-O(CH2)2OH	OCH2Br	2-CF3	OCH2Br	2-Cl-6-O ⁿ Pr
OCF3	2-O(CH2)2OMe	OCH2Br	3-CF3	OCH2Br	2-Cl-6-O ⁱ Pr
OCF3	2-O(CH2)2OCH2OMe	OCH2Br	3,5-CF3		
OCF3	2-O(CH2)2Cl	OCH2Br	2-OMe		
OCF3	2-O(CH2)2Br	OCH2Br	2-OEt		
OCF3	2-OC(O)Me	OCH2Br	2-O ⁱ Pr		
OCF3	2-C(O)Et	OCH2Br	2-O ⁿ Pr		
OCF3	2-OC(O)SMe	OCH2Br	2-O ⁿ Bu		
OCF3	2-CN	OCH2Br	2-O ⁱ Bu		
OCF3	2-CHO	OCH2Br	2-OHex		
OCF3	2-NO2	OCH2Br	2-OAc		
OCF3	2-NH2	OCH2Br	2-Oallyl		
OCF3	2-NHEt	OCH2Br	2-Oallenyl		
OCF3	2-N(ⁿ Pr)2	OCH2Br	2-Opropargyl		

【表 8】

第1表つぎ

R1a	R1b	R1a	R1b	R1a	R1b
OCH ₂ Ph	H	OCH ₂ Ph	2-NH ⁿ Pr	OCH ₂ (Naph-1yl)	2-OCH ₂ ^c Pr
OCH ₂ Ph	2-OH	OCH ₂ Ph	2-N(Ac) ⁿ Pr	OCH ₂ (Naph-1yl)	2-OCH ₂ CH=CCl ₂
OCH ₂ Ph	2-Me	OCH ₂ Ph	2-NH ₂ -6-Cl	OCH ₂ (Naph-1yl)	2-OCH ₂ ^t Bu
OCH ₂ Ph	1,6-Me ₃	OCH ₂ Ph	2-CH ₂ OMe	OCH ₂ (Naph-1yl)	2-O(CH ₂) ₂ OH
OCH ₂ Ph	2-Et	OCH ₂ Ph	2-CH ₂ OEt	OCH ₂ (Naph-1yl)	2-O(CH ₂) ₂ OMe
OCH ₂ Ph	2-allyl	OCH ₂ Ph	2-CH ₂ ^t Bu	OCH ₂ (Naph-1yl)	2-O(CH ₂) ₂ OCH ₂ OMe
OCH ₂ Ph	2- ⁱ Pr	OCH ₂ Ph	2-CH ₂ OCH ₂ OMe	OCH ₂ (Naph-1yl)	2-O(CH ₂) ₂ Cl
OCH ₂ Ph	2- ⁿ Pr	OCH ₂ Ph	2-CH(OH)Et	OCH ₂ (Naph-1yl)	2-O(CH ₂) ₂ Br
OCH ₂ Ph	2-F	OCH ₂ Ph	2-CH ₂ OH	OCH ₂ (Naph-1yl)	2-OC(O)Me
OCH ₂ Ph	2-Cl	OCH ₂ Ph	2-CH ₂ Cl	OCH ₂ (Naph-1yl)	2-C(O)Et
OCH ₂ Ph	2-Br	OCH ₂ Ph	2-CH=CHMe	OCH ₂ (Naph-1yl)	2-OC(O)SMe
OCH ₂ Ph	2-I	OCH ₂ Ph	2-CH(Cl)Et	OCH ₂ (Naph-1yl)	2-CN
OCH ₂ Ph	2,6-Cl ₂	OCH ₂ Ph	2-CH ₂ OCH ₂ OMe	OCH ₂ (Naph-1yl)	2-CHO
OCH ₂ Ph	2,3,6-Cl ₃	OCH ₂ Ph	2-CH ₂ OCH ₂ OEt	OCH ₂ (Naph-1yl)	2-NO ₂
OCH ₂ Ph	2-Br-6-Cl	OCH ₂ Ph	2-Cl-6-NO ₂	OCH ₂ (Naph-1yl)	2-NH ₂
OCH ₂ Ph	2-CF ₃	OCH ₂ Ph	2-Cl-6-O ⁿ Pr	OCH ₂ (Naph-1yl)	2-NHEt
OCH ₂ Ph	3-CF ₃	OCH ₂ Ph	2-Cl-6-O ⁱ Pr	OCH ₂ (Naph-1yl)	2-N(ⁿ Pr) ₂
OCH ₂ Ph	3,5-CF ₃	OCH ₂ (Naph-1yl)	H	OCH ₂ (Naph-1yl)	2-NH ⁿ Pr
OCH ₂ Ph	2-OMe	OCH ₂ (Naph-1yl)	2-OH	OCH ₂ (Naph-1yl)	2-N(Ac) ⁿ Pr
OCH ₂ Ph	2-OEt	OCH ₂ (Naph-1yl)	2-Me	OCH ₂ (Naph-1yl)	2-NH ₂ -6-Cl
OCH ₂ Ph	2-O ⁱ Pr	OCH ₂ (Naph-1yl)	1,6-Me ₃	OCH ₂ (Naph-1yl)	2-CH ₂ OMe
OCH ₂ Ph	2-O ⁿ Pr	OCH ₂ (Naph-1yl)	2-Et	OCH ₂ (Naph-1yl)	2-CH ₂ OEt
OCH ₂ Ph	2-O ⁿ Bu	OCH ₂ (Naph-1yl)	2-allyl	OCH ₂ (Naph-1yl)	2-CH ₂ ^t Bu
OCH ₂ Ph	2-O ⁱ Bu	OCH ₂ (Naph-1yl)	2- ⁱ Pr	OCH ₂ (Naph-1yl)	2-CH ₂ OCH ₂ OMe
OCH ₂ Ph	2-OHex	OCH ₂ (Naph-1yl)	2- ⁿ Pr	OCH ₂ (Naph-1yl)	2-CH(OH)Et
OCH ₂ Ph	2-OAc	OCH ₂ (Naph-1yl)	2-F	OCH ₂ (Naph-1yl)	2-CH ₂ OH
OCH ₂ Ph	2-Oallyl	OCH ₂ (Naph-1yl)	2-Cl	OCH ₂ (Naph-1yl)	2-CH ₂ Cl
OCH ₂ Ph	2-Oallenyl	OCH ₂ (Naph-1yl)	2-Br	OCH ₂ (Naph-1yl)	2-CH=CHMe
OCH ₂ Ph	2-Opropargyl	OCH ₂ (Naph-1yl)	2-I	OCH ₂ (Naph-1yl)	2-CH(Cl)Et
OCH ₂ Ph	2-OCH ₂ ^c Pr	OCH ₂ (Naph-1yl)	2,6-Cl ₂	OCH ₂ (Naph-1yl)	2-CH ₂ OCH ₂ OMe
OCH ₂ Ph	2-OCH ₂ CH=CCl ₂	OCH ₂ (Naph-1yl)	2,3,6-Cl ₃	OCH ₂ (Naph-1yl)	2-CH ₂ OCH ₂ OEt
OCH ₂ Ph	2-OCH ₂ ^t Bu	OCH ₂ (Naph-1yl)	2-Br-6-Cl	OCH ₂ (Naph-1yl)	2-Cl-6-NO ₂
OCH ₂ Ph	2-O(CH ₂) ₂ OH	OCH ₂ (Naph-1yl)	2-CF ₃	OCH ₂ (Naph-1yl)	2-Cl-6-O ⁿ Pr
OCH ₂ Ph	2-O(CH ₂) ₂ OMe	OCH ₂ (Naph-1yl)	3-CF ₃	OCH ₂ (Naph-1yl)	2-Cl-6-O ⁱ Pr
OCH ₂ Ph	2-O(CH ₂) ₂ OCH ₂ OMe	OCH ₂ (Naph-1yl)	3,5-CF ₃		
OCH ₂ Ph	2-O(CH ₂) ₂ Cl	OCH ₂ (Naph-1yl)	2-OMe		
OCH ₂ Ph	2-O(CH ₂) ₂ Br	OCH ₂ (Naph-1yl)	2-OEt		
OCH ₂ Ph	2-OC(O)Me	OCH ₂ (Naph-1yl)	2-O ⁱ Pr		
OCH ₂ Ph	2-C(O)Et	OCH ₂ (Naph-1yl)	2-O ⁿ Pr		
OCH ₂ Ph	2-OC(O)SMe	OCH ₂ (Naph-1yl)	2-O ⁿ Bu		
OCH ₂ Ph	2-CN	OCH ₂ (Naph-1yl)	2-O ⁱ Bu		
OCH ₂ Ph	2-CHO	OCH ₂ (Naph-1yl)	2-OHex		
OCH ₂ Ph	2-NO ₂	OCH ₂ (Naph-1yl)	2-OAc		
OCH ₂ Ph	2-NH ₂	OCH ₂ (Naph-1yl)	2-Oallyl		
OCH ₂ Ph	2-NHEt	OCH ₂ (Naph-1yl)	2-Oallenyl		
OCH ₂ Ph	2-N(ⁿ Pr) ₂	OCH ₂ (Naph-1yl)	2-Opropargyl		

【表 9】

第1表つづき

R1a	R1b	R1a	R1b	R1a	R1b
NH2	H	NH2	2-NH ⁿ Pr	S(O)CF3	2-OCH2 ⁿ Pr
NH2	2-OH	NH2	2-N(Ac) ⁿ Pr	S(O)CF3	2-OCH2CH=CCl2
NH2	2-Me	NH2	2-NH2-6-Cl	S(O)CF3	2-OCH2 ¹ Bu
NH2	1,6-Me3	NH2	2-CH2OMe	S(O)CF3	2-O(CH2)2OH
NH2	2-Et	NH2	2-CH2OEt	S(O)CF3	2-O(CH2)2OMe
NH2	2-allyl	NH2	2-CH2 ¹ Bu	S(O)CF3	2-O(CH2)2OCH2OMe
NH2	2- ¹ Pr	NH2	2-CH2OCH2OMe	S(O)CF3	2-O(CH2)2Cl
NH2	2- ⁿ Pr	NH2	2-CH(OH)Et	S(O)CF3	2-O(CH2)2Br
NH2	2-F	NH2	2-CH2OH	S(O)CF3	2-OC(O)Me
NH2	2-Cl	NH2	2-CH2Cl	S(O)CF3	2-C(O)Et
NH2	2-Br	NH2	2-CH=CHMe	S(O)CF3	2-OC(O)SMe
NH2	2-I	NH2	2-CH(Cl)Et	S(O)CF3	2-CN
NH2	2,6-Cl2	NH2	2-CH2OCH2OMe	S(O)CF3	2-CHO
NH2	2,3,6-Cl3	NH2	2-CH2OCH2OEt	S(O)CF3	2-NO2
NH2	2-Br-6-Cl	NH2	2-Cl-6-NO2	S(O)CF3	2-NH2
NH2	2-CF3	NH2	2-Cl-6-O ⁿ Pr	S(O)CF3	2-NHEt
NH2	3-CF3	NH2	2-Cl-6-O ¹ Pr	S(O)CF3	2-N(ⁿ Pr)2
NH2	3,5-CF3	S(O)CF3	H	S(O)CF3	2-NH ⁿ Pr
NH2	2-OMe	S(O)CF3	2-OH	S(O)CF3	2-N(Ac) ⁿ Pr
NH2	2-OEt	S(O)CF3	2-Me	S(O)CF3	2-NH2-6-Cl
NH2	2-O ¹ Pr	S(O)CF3	1,6-Me3	S(O)CF3	2-CH2OMe
NH2	2-O ⁿ Pr	S(O)CF3	2-Et	S(O)CF3	2-CH2OEt
NH2	2-O ⁿ Bu	S(O)CF3	2-allyl	S(O)CF3	2-CH2 ¹ Bu
NH2	2-O ¹ Bu	S(O)CF3	2- ¹ Pr	S(O)CF3	2-CH2OCH2OMe
NH2	2-OHex	S(O)CF3	2- ⁿ Pr	S(O)CF3	2-CH(OH)Et
NH2	2-OAc	S(O)CF3	2-F	S(O)CF3	2-CH2OH
NH2	2-Oallyl	S(O)CF3	2-Cl	S(O)CF3	2-CH2Cl
NH2	2-Oallenyl	S(O)CF3	2-Br	S(O)CF3	2-CH=CHMe
NH2	2-Opropargyl	S(O)CF3	2-I	S(O)CF3	2-CH(Cl)Et
NH2	2-OCH2 ⁿ Pr	S(O)CF3	2,6-Cl2	S(O)CF3	2-CH2OCH2OMe
NH2	2-OCH2CH=CCl2	S(O)CF3	2,3,6-Cl3	S(O)CF3	2-CH2OCH2OEt
NH2	2-OCH2 ¹ Bu	S(O)CF3	2-Br-6-Cl	S(O)CF3	2-Cl-6-NO2
NH2	2-O(CH2)2OH	S(O)CF3	2-CF3	S(O)CF3	2-Cl-6-O ⁿ Pr
NH2	2-O(CH2)2OMe	S(O)CF3	3-CF3	S(O)CF3	2-Cl-6-O ¹ Pr
NH2	2-O(CH2)2OCH2OMe	S(O)CF3	3,5-CF3		
NH2	2-O(CH2)2Cl	S(O)CF3	2-OMe		
NH2	2-O(CH2)2Br	S(O)CF3	2-OEt		
NH2	2-OC(O)Me	S(O)CF3	2-O ¹ Pr		
NH2	2-C(O)Et	S(O)CF3	2-O ⁿ Pr		
NH2	2-OC(O)SMe	S(O)CF3	2-O ⁿ Bu		
NH2	2-CN	S(O)CF3	2-O ¹ Bu		
NH2	2-CHO	S(O)CF3	2-OHex		
NH2	2-NO2	S(O)CF3	2-OAc		
NH2	2-NH2	S(O)CF3	2-Oallyl		
NH2	2-NHEt	S(O)CF3	2-Oallenyl		
NH2	2-N(ⁿ Pr)2	S(O)CF3	2-Opropargyl		

【表 10】

第1表つづき

R1a	R1b	R1a	R1b	R1a	R1b
OSO2CF3H		OSO2CF3	2-NH ⁿ Pr	OC(O)Ph	2-OCH2 ^c Pr
OSO2CF32-OH		OSO2CF3	2-N(Ac) ⁿ Pr	OC(O)Ph	2-OCH2CH=CCl2
OSO2CF32-Me		OSO2CF3	2-NH2-6-Cl	OC(O)Ph	2-OCH2 ^t Bu
OSO2CF31,6-Me3		OSO2CF3	2-CH2OMe	OC(O)Ph	2-O(CH2)2OH
OSO2CF32-Et		OSO2CF3	2-CH2OEt	OC(O)Ph	2-O(CH2)2OMe
OSO2CF32-allyl		OSO2CF3	2-CH2 ^t Bu	OC(O)Ph	2-O(CH2)2OCH2OMe
OSO2CF32- ⁱ Pr		OSO2CF3	2-CH2OCH2OMe	OC(O)Ph	2-O(CH2)2Cl
OSO2CF32- ⁿ Pr		OSO2CF3	2-CH(OH)Et	OC(O)Ph	2-O(CH2)2Br
OSO2CF32-F		OSO2CF3	2-CH2OH	OC(O)Ph	2-OC(O)Me
OSO2CF32-Cl		OSO2CF3	2-CH2Cl	OC(O)Ph	2-C(O)Et
OSO2CF32-Br		OSO2CF3	2-CH=CHMe	OC(O)Ph	2-OC(O)SMe
OSO2CF32-I		OSO2CF3	2-CH(Cl)Et	OC(O)Ph	2-CN
OSO2CF32,6-Cl2		OSO2CF3	2-CH2OCH2OMe	OC(O)Ph	2-CHO
OSO2CF32,3,6-Cl3		OSO2CF3	2-CH2OCH2OEt	OC(O)Ph	2-NO2
OSO2CF32-Br-6-Cl		OSO2CF3	2-Cl-6-NO2	OC(O)Ph	2-NH2
OSO2CF32-CF3		OSO2CF3	2-Cl-6-O ⁿ Pr	OC(O)Ph	2-NHEt
OSO2CF33-CF3		OSO2CF3	2-Cl-6-O ⁱ Pr	OC(O)Ph	2-N(ⁿ Pr)2
OSO2CF33,5-CF3		OC(O)Ph	H	OC(O)Ph	2-NH ⁿ Pr
OSO2CF32-OMe		OC(O)Ph	2-OH	OC(O)Ph	2-N(Ac) ⁿ Pr
OSO2CF32-OEt		OC(O)Ph	2-Me	OC(O)Ph	2-NH2-6-Cl
OSO2CF32-O ⁱ Pr		OC(O)Ph	1,6-Me3	OC(O)Ph	2-CH2OMe
OSO2CF32-O ⁿ Pr		OC(O)Ph	2-Et	OC(O)Ph	2-CH2OEt
OSO2CF32-O ⁿ Bu		OC(O)Ph	2-allyl	OC(O)Ph	2-CH2 ^t Bu
OSO2CF32-O ⁱ Bu		OC(O)Ph	2- ⁱ Pr	OC(O)Ph	2-CH2OCH2OMe
OSO2CF32-CHex		OC(O)Ph	2- ⁿ Pr	OC(O)Ph	2-CH(OH)Et
OSO2CF32-OAc		OC(O)Ph	2-F	OC(O)Ph	2-CH2OH
OSO2CF32-Oallyl		OC(O)Ph	2-Cl	OC(O)Ph	2-CH2Cl
OSO2CF32-Oallynyl		OC(O)Ph	2-Br	OC(O)Ph	2-CH=CHMe
OSO2CF32-Opropargyl		OC(O)Ph	2-I	OC(O)Ph	2-CH(Cl)Et
OSO2CF32-OCH2 ^c Pr		OC(O)Ph	2,6-Cl2	OC(O)Ph	2-CH2OCH2OMe
OSO2CF32-OCH2CH=CCl2		OC(O)Ph	2,3,6-Cl3	OC(O)Ph	2-CH2OCH2OEt
OSO2CF32-OCH2 ^t Bu		OC(O)Ph	2-Br-6-Cl	OC(O)Ph	2-Cl-6-NO2
OSO2CF32-O(CH2)2OH		OC(O)Ph	2-CF3	OC(O)Ph	2-Cl-6-O ⁿ Pr
OSO2CF32-O(CH2)2OMe		OC(O)Ph	3-CF3	OC(O)Ph	2-Cl-6-O ⁱ Pr
OSO2CF32-O(CH2)2OCH2OMe		OC(O)Ph	3,5-CF3		
OSO2CF32-O(CH2)2Cl		OC(O)Ph	2-OMe		
OSO2CF32-O(CH2)2Br		OC(O)Ph	2-OEt		
OSO2CF32-OC(O)Me		OC(O)Ph	2-O ⁱ Pr		
OSO2CF32-C(O)Et		OC(O)Ph	2-O ⁿ Pr		
OSO2CF32-OC(O)SMe		OC(O)Ph	2-O ⁿ Bu		
OSO2CF32-CN		OC(O)Ph	2-O ⁱ Bu		
OSO2CF32-CHO		OC(O)Ph	2-CHex		
OSO2CF32-NO2		OC(O)Ph	2-OAc		
OSO2CF32-NH2		OC(O)Ph	2-Oallyl		
OSO2CF32-NHEt		OC(O)Ph	2-Oallynyl		
OSO2CF32-N(ⁿ Pr)2		OC(O)Ph	2-Opropargyl		

【表 1 1】

第1表つづき

R1a	R1b	R1a	R1b	R1a	R1b
SCF3	H	SCF3	2-NH ⁿ Pr	N(SO2)Me2	2-OCH2 ^c Pr
SCF3	2-OH	SCF3	2-N(Ac) ⁿ Pr	N(SO2)Me2	2-OCH2CH=CCl2
SCF3	2-Me	SCF3	2-NH2-6-Cl	N(SO2)Me2	2-OCH2 ^t Bu
SCF3	1,6-Me3	SCF3	2-CH2OMe	N(SO2)Me2	2-O(CH2)2OH
SCF3	2-Et	SCF3	2-CH2OEt	N(SO2)Me2	2-O(CH2)2OMe
SCF3	2-allyl	SCF3	2-CH2 ^t Bu	N(SO2)Me2	2-O(CH2)2OCH2OMe
SCF3	2- ⁱ Pr	SCF3	2-CH2OCH2OMe	N(SO2)Me2	2-O(CH2)2Cl
SCF3	2- ⁿ Pr	SCF3	2-CH(OH)Et	N(SO2)Me2	2-O(CH2)2Br
SCF3	2-F	SCF3	2-CH2OH	N(SO2)Me2	2-OC(O)Me
SCF3	2-Cl	SCF3	2-CH2Cl	N(SO2)Me2	2-C(O)Et
SCF3	2-Br	SCF3	2-CH=CHMe	N(SO2)Me2	2-OC(O)SMe
SCF3	2-I	SCF3	2-CH(Cl)Et	N(SO2)Me2	2-CN
SCF3	2,6-Cl2	SCF3	2-CH2OCH2OMe	N(SO2)Me2	2-CHO
SCF3	2,3,6-Cl3	SCF3	2-CH2OCH2OEt	N(SO2)Me2	2-NO2
SCF3	2-Br-6-Cl	SCF3	2-Cl-6-NO2	N(SO2)Me2	2-NH2
SCF3	2-CF3	SCF3	2-Cl-6-O ⁿ Pr	N(SO2)Me2	2-NHEt
SCF3	3-CF3	SCF3	2-Cl-6-O ⁱ Pr	N(SO2)Me2	2-N(ⁿ Pr)2
SCF3	3,5-CF3	N(SO2)Me2	H	N(SO2)Me2	2-NH ⁿ Pr
SCF3	2-OMe	N(SO2)Me2	2-OH	N(SO2)Me2	2-N(Ac) ⁿ Pr
SCF3	2-OEt	N(SO2)Me2	2-Me	N(SO2)Me2	2-NH2-6-Cl
SCF3	2-O ⁱ Pr	N(SO2)Me2	1,6-Me3	N(SO2)Me2	2-CH2OMe
SCF3	2-O ⁿ Pr	N(SO2)Me2	2-Et	N(SO2)Me2	2-CH2OEt
SCF3	2-O ⁿ Bu	N(SO2)Me2	2-allyl	N(SO2)Me2	2-CH2 ^t Bu
SCF3	2-O ⁱ Bu	N(SO2)Me2	2- ⁱ Pr	N(SO2)Me2	2-CH2OCH2OMe
SCF3	2-OHex	N(SO2)Me2	2- ⁿ Pr	N(SO2)Me2	2-CH(OH)Et
SCF3	2-OAc	N(SO2)Me2	2-F	N(SO2)Me2	2-CH2OH
SCF3	2-Oallyl	N(SO2)Me2	2-Cl	N(SO2)Me2	2-CH2Cl
SCF3	2-Oallenyl	N(SO2)Me2	2-Br	N(SO2)Me2	2-CH=CHMe
SCF3	2-Opropargyl	N(SO2)Me2	2-I	N(SO2)Me2	2-CH(Cl)Et
SCF3	2-OCH2 ^c Pr	N(SO2)Me2	2,6-Cl2	N(SO2)Me2	2-CH2OCH2OMe
SCF3	2-OCH2CH=CCl2	N(SO2)Me2	2,3,6-Cl3	N(SO2)Me2	2-CH2OCH2OEt
SCF3	2-OCH2 ^t Bu	N(SO2)Me2	2-Br-6-Cl	N(SO2)Me2	2-Cl-6-NO2
SCF3	2-O(CH2)2OH	N(SO2)Me2	2-CF3	N(SO2)Me2	2-Cl-6-O ⁿ Pr
SCF3	2-O(CH2)2OMe	N(SO2)Me2	3-CF3	N(SO2)Me2	2-Cl-6-O ⁱ Pr
SCF3	2-O(CH2)2OCH2OMe	N(SO2)Me2	3,5-CF3		
SCF3	2-O(CH2)2Cl	N(SO2)Me2	2-OMe		
SCF3	2-O(CH2)2Br	N(SO2)Me2	2-OEt		
SCF3	2-OC(O)Me	N(SO2)Me2	2-O ⁱ Pr		
SCF3	2-C(O)Et	N(SO2)Me2	2-O ⁿ Pr		
SCF3	2-OC(O)SMe	N(SO2)Me2	2-O ⁿ Bu		
SCF3	2-CN	N(SO2)Me2	2-O ⁱ Bu		
SCF3	2-CHO	N(SO2)Me2	2-OHex		
SCF3	2-NO2	N(SO2)Me2	2-OAc		
SCF3	2-NH2	N(SO2)Me2	2-Oallyl		
SCF3	2-NHEt	N(SO2)Me2	2-Oallenyl		
SCF3	2-N(ⁿ Pr)2	N(SO2)Me2	2-Opropargyl		

【0034】

(有害生物防除剤)

本発明化合物は、有害生物防除剤の有効成分として有用であり、特に、殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、衛生害虫防除剤や水中付着生物防汚剤として有用である。

本発明化合物(式(1))で表される化合物又はその塩)は農業上の有害生物、衛生害虫、貯穀害虫、衣類害虫、家屋害虫等の防除に使用でき、殺成虫、殺若虫、殺幼虫、殺卵作用を有する。その代表例として、下記のもものが挙げられる。

【0035】

鱗翅目害虫、例えば、ハスモンヨトウ、ヨトウガ、タマナヤガ、アオムシ、タマナギン

ウワバ、コナガ、チャノコカクモンハマキ、チャハマキ、モモシנקイガ、ナシヒメシ
クイ、ミカンハモグリガ、チャノホソガ、キンモンホソガ、マイマイガ、チャドクガ、ニ
カメイガ、コブノメイガ、ヨーロッパンコーンボーラー、アメリカシロヒトリ、スジマダ
ラメイガ、ヘリオティス属、ヘリコベルバ属、アグロティス属、イガ、コドリリング、ワタ
アカミムシ等、

半翅目害虫、例えば、モモアカアブラムシ、ワタアブラムシ、ニセダイコンアブラムシ
、ムギクビレアブラムシ、ホソヘリカメムシ、アオクサカメムシ、ヤノネカイガラムシ、
クワコナカイガラムシ、オンシツコナジラミ、タバココナジラミ、シルバーリーフコナジ
ラミ、ナシキジラミ、ナシグンバイムシ、トビイロウンカ、ヒメトビウンカ、セジロウン
カ、ツマグロヨコバイ等、

甲虫目害虫、例えば、キスジノミハムシ、ウリハムシ、コロラドハムシ、イネミズゾウ
ムシ、コクゾウムシ、アズキゾウムシ、マメコガネ、ヒメコガネ、ジアプロティカ属、タ
バコシバンムシ、ヒラタキクイムシ、マツノマダラカミキリ、ゴマダラカミキリ、アグリ
オティス属、ニジュウヤホシテントウ、コクヌスト、ワタミゾウムシ等、

双翅目害虫、例えば、イエバエ、オオクロバエ、センチュウバエ、ウリミバエ、ミカン
コミバエ、タネバエ、イネハモグリバエ、キイロショウジョウバエ、サシバエ、コガタア
カイエカ、ネツタイシマカ、シナハマダラカ等、

アザミウマ目害虫、例えば、ミナミキイロアザミウマ、チャノキイロアザミウマ等、

膜翅目害虫、例えば、イエヒメアリ、キイロスズメバチ、カブラハバチ等、

直翅目害虫、例えば、トノサマバッタ、チャバネゴキブリ、ワモンゴキブリ、クロゴキ
ブリ等

シロアリ目害虫、例えば、イエシロアリ、ヤマトシロアリ等、

隠翅目害虫、例えば、ヒトノミ、ネコノミ等、シラミ目害虫、例えば、ヒトジラミ等、

ダニ類、例えば、ナミハダニ、ニセナミハダニ、カンザワハダニ、ミカンハダニ、リン
ゴハダニ、ミカンサビダニ、リンゴサビダニ、チャノホコリダニ、プレビバルパス属、エ
オテトラニカス属、ロビンネダニ、ケナガコナダニ、コナヒョウヒダニ、オウシマダニ、
フタトゲチマダニ等、

植物寄生性線虫類、例えば、サツマイモネコブセンチュウ、ネグサレセンチュウ、ダイ
ズリストセンチュウ、イネシガラセンチュウ、マツノザイセンチュウ等。

【0036】

適用が好ましい有害生物としては、鱗翅目害虫、半翅目害虫、ダニ類、アザミウマ目害
虫、甲虫目害虫であり、特に好ましくはダニ類である。

【0037】

又、近年コナガ、ウンカ、ヨコバイ、アブラムシ等多くの害虫において有機リン剤、カ
ーバメート剤や殺ダニ剤に対する抵抗性が発達し、それら薬剤の効力不足問題を生じてお
り、抵抗性系統の害虫やダニにも有効な薬剤が望まれている。本発明化合物は感受性系統
のみならず、有機リン剤、カーバメート剤、ピレスロイド剤抵抗性系統の害虫や、殺ダニ
剤抵抗性系統のダニにも優れた殺虫殺ダニ効果を有する薬剤である。

【0038】

また本発明化合物は薬害が少なく、魚類や温血動物への毒性が低く、安全性の高い薬剤
である。

【0039】

本発明化合物は、水棲生物が船底、魚網等の水中接触物に付着するのを防止するための
防汚剤として使用することもできる。

【0040】

本発明化合物の中には、殺菌活性、除草活性、植調作用を示すものもある。また本発明
化合物の中間体化合物の中には殺虫・殺ダニ活性を示すものもある。

【0041】

本発明殺虫・殺ダニ剤は本発明化合物の1種又は2種以上を有効成分として含有する。
本発明化合物を実際に施用する際には他成分を加えずそのまま使用できるが、通常は、さ

らに固体担体、液体担体、ガス状担体と混合し、または多孔セラミック板や不織布等の基剤に含浸し、必要により界面活性剤、その他の補助剤を添加して、農薬として使用する目的で一般の農薬のとり得る形態、即ち、水和剤、粒剤、粉剤、乳剤、水溶剤、懸濁剤、顆粒水和剤、フロアブル、エアゾール、煙霧剤、加熱蒸散剤、燻煙剤、毒餌、マイクロカプセル等の形態に製剤化して使用する。

【0042】

添加剤および担体としては固型剤を目的とする場合は、大豆粒、小麦粉等の植物性粉末、珪藻土、燐灰石、石こう、タルク、ベントナイト、パイロフィライト、クレイ等の鉱物性微粉末、安息香酸ソーダ、尿素、芒硝等の有機及び無機化合物が使用される。液体の剤型を目的とする場合は、ケロシン、キシレンおよびソルベントナフサ等の石油留分、シクロヘキサン、シクロヘキサノン、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、アルコール、アセトン、メチルイソブチルケトン、鉱物油、植物油、水等を溶剤として使用することができる。噴射剤に用いられるガス状担体としては、ブタンガス、LPG、ジメチルエーテルおよび炭酸ガスを使用することができる。

【0043】

毒餌の基材としては、例えば穀物粉、植物油、糖、結晶セルロース等の餌成分、ジブチルヒドロキシトルエン、ノルジヒドロゲアイアレチック酸等の酸化防止剤、デヒドロ酢酸等の保存料、トウガラシ末等の子供やペットによる誤食防止剤、チーズ香料、タマネギ香料等の害虫誘引性香料を使用することができる。

【0044】

これらの製剤において均一かつ安定な形態をとるために、必要ならば界面活性剤を添加することもできる。界面活性剤としては、特に限定はないが、例えば、ポリオキシエチレンが付加したアルキルエーテル、ポリオキシエチレンが付加した高級脂肪酸エステル、ポリオキシエチレンが付加したソルビタン高級脂肪酸エステル、ポリオキシエチレンが付加したトリスチリルフェニルエーテル等の非イオン性界面活性剤、ポリオキシエチレンが付加したアルキルフェニルエーテルの硫酸エステル塩、アルキルナフタレンスルホン酸塩、ポリカルボン酸塩、リグニンスルホン酸塩、アルキルナフタレンスルホン酸塩のホルムアルデヒド縮合物、イソブチレン-無水マレイン酸の共重合体等が挙げられる。

【0045】

本発明化合物を農業用の有害生物防除剤として使用する場合は、その製剤中の有効成分量は0.01～90重量%であり、とくに好ましくは0.05～85重量%であり、水和剤、乳剤、懸濁剤、フロアブル剤、水溶剤、顆粒水和剤は水で所定の濃度に希釈して、溶解液、懸濁液あるいは乳濁液として、粉剤・粒剤はそのまま植物或いは土壌に散布する方法で使用される。

【0046】

また、本発明化合物を防疫用の有害生物防除剤として使用する場合には、乳剤、水和剤、フロアブル剤等は水で所定の濃度に希釈して施用し、油剤、エアゾール、煙霧剤、毒餌、防ダニシート等についてはそのまま施用する。

【0047】

本発明化合物をウシ、ブタ等の家畜類、イヌ、ネコ等のペット等の動物外部寄生虫防除用の有害生物防除剤として使用する場合は、通常本発明化合物の製剤を、獣医学的に公知の方法で使用する。その方法としては、例えば全身的抑制(systemic control)を目的とする場合には、錠剤、カプセル、浸漬液、飼料混入、坐薬、注射(筋肉内、皮下、静脈内、腹腔内等)等により投与する方法が挙げられ、非全身的(non-systemic control)を目的とする場合は、油性又は水性液剤を噴霧、注ぎかけ(pour-on)、滴下(spot-on)等により投与する方法および樹脂製剤を首輪、耳札等の適当な形状に成形した物を装着する方法が挙げられる。この場合、通常宿主動物1kgに対して、本発明化合物として0.01～1000mgの割合で使用される。

【0048】

なお、本発明化合物は単独でも十分有効であることは言うまでもないが、他の有害性物防除剤、殺菌剤、殺虫・殺ダニ剤、除草剤、植物調節剤、共力剤、肥料、土壌改良剤、動物用飼料等の1種又は2種以上と混用または併用することもできる。

【0049】

本発明化合物と混用または併用することのできる殺菌剤、殺虫剤、殺ダニ剤、植物生長調節剤等の有効成分の代表例を以下に示す。

【0050】

殺菌剤：

キャブタン、フォルベット、チウラム、ジラム、ジネブ、マンネブ、マンコゼブ、プロピネブ、ポリカーバメート、クロロタロニン、キントーゼン、キャブタホル、イプロジオン、プロサイミドン、ピンクロゾリン、フルオロイミド、サイモキサニル、メプロニル、フルトラニル、ベンシクロン、オキシカルボキシシン、ホセチルアルミニウム、プロバモカーブ、トリアジメホン、トリアジメノール、プロピコナゾール、ジクロブトラゾール、ピテルタノール、ヘキサコナゾール、マイクロブタニル、フルシラゾール、エタコナゾール、フルオトリマゾール、フルトリアフェン、ベンコナゾール、ジニコナゾール、サイプロコナゾール、フェナリモール、トリフルミゾール、プロクロラズ、イマザリル、ペフラゾエート、トリデモルフ、フェンプロピモルフ、トリホリン、ブチオベート、ピリフェノックス、アニラジン、ポリオキシシン、メタラキシル、オキサジキシル、フララキシル、イソプロチオラン、プロベナゾール、ピロールニトリン、ブラストサイジンS、カスガマイシン、バリダマイシン、硫酸ジヒドロストレプトマイシン、ベノミル、カルベンダジム、チオフアネートメチル、ヒメキサゾール、塩基性塩化銅、塩基性硫酸銅、フェンチンアセテート、水酸化トリフェニル錫、ジエトフェンカルブ、メタスルホカルブ、キノメチオナー、ピナバクリル、レシチン、重曹、ジチアノン、ジノカップ、フェナミノスルフ、ジクロメジン、グアザチン、ドジン、IBP、エディフェンホス、メバニピリム、フェルムゾン、トリクラミド、メタスルホカルブ、フルアジナム、エトキノラック、ジメトモルフ、ピロキロン、テクロフタラム、フサライド、フェナジンオキシド、チアベンダゾール、トリシクラゾール、ピンクロゾリン、シモキサニル、シクロブタニル、グアザチン、プロバモカルブ塩酸塩、オキシソリニク酸。

【0051】

殺虫・殺ダニ剤：

有機燐およびカーバメート系殺虫剤：

フェンチオン、フェニトロチオン、ダイアジノン、クロルピリホス、ESP、バミドチオン、フェントエート、ジメトエート、ホルモチオン、マラソン、トリクロロホン、チオメトン、ホスメット、ジクロロボス、アセフェート、EPBP、メチルバラチオン、オキシジメトンメチル、エチオン、サリチオン、シアノホス、イソキサチオン、ピリダフェンチオン、ホサロン、メチダチオン、スルプロホス、クロルフェンピンホス、テトラクロルピンホス、ジメチルピンホス、プロバホス、イソフェンホス、エチルチオメトン、プロフェノホス、ピラクロホス、モノクロトホス、アジンホスメチル、アルディカルブ、メソミル、チオジカルブ、カルボフラン、カルボスルフェン、ベンフラカルブ、フラチオカルブ、プロボキスル、BPMC、MTMC、MIPC、カルバリル、ピリミカーブ、エチオフェンカルブ、フェノキシカルブ、カルタップ、チオシクラム、ベンスルタップ等。

【0052】

ピレスロイド系殺虫剤：

ベルメトリン、シベルメトリン、デルタメスリン、フェンバレレート、フェンプロバトリン、ピレトリン、アレスリン、テトラメスリン、レスメトリン、ジメスリン、プロバスリン、フェノトリン、プロトリン、フルバリネート、シフルトリン、シハロトリン、フルシトリネート、エトフェンプロックス、シクロプロトリン、トラロメトリン、シラフルオフェン、アクリナトリン等。

【0053】

ベンゾイルウレア系その他の殺虫剤：

ジフルベンズロン、クロルフルアズロン、ヘキサフルムロン、トリフルムロン、テトラベンズロン、フルフェノクスロン、フルシクロクスロン、ブプロフェジン、ピリプロキシフェン、メトプレン、ベンゾエピン、ジアフェンチウロン、イミダクロプリド、フィプロニル、硫酸ニコチン、ロテノン、メタアルデヒド、機械油、BTや昆虫病原ウイルスなどの微生物農薬等。

【0054】

殺線虫剤：

フェナミホス、ホスチアゼート等。

【0055】

殺ダニ剤：

クロルベンジレート、フェニソプロモレート、ジコホル、アミトラズ、BPPS、ベンゾメート、ヘキシチアゾクス、酸化フェンブタスズ、ポリナクチン、キノメチオネート、CPCBS、テトラジホン、アベルメクチン、ミルベメクチン、クロフェンテジン、シヘキサチン、ピリダベン、フェンピロキシメート、テブフェンピラド、ピリミジフェン、フェノチオカルブ、ジエノクロル等。

【0056】

植物生長調節剤：

ジベレリン類（例えばジベレリンA3、ジベレリンA4、ジベレリンA7）IAA、NAA。

【実施例】

【0057】

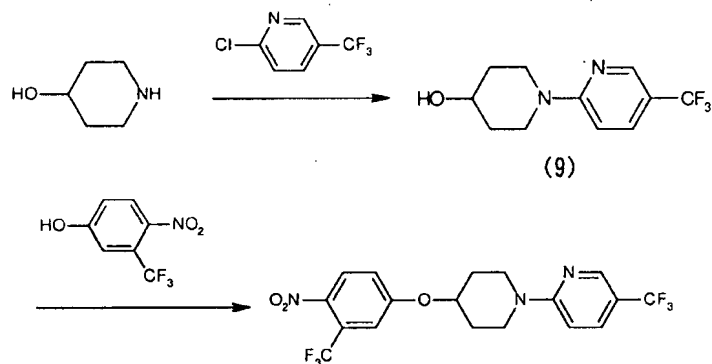
次に、実施例を挙げて、本発明をさらに詳細に説明する。

実施例1

4-[4-Nitro-3-(trifluoromethyl)phenoxy]-1-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]piperidineの製造（化合物番号1-12）

【0058】

【化6】



【0059】

4-ヒドロキシピペリジン（3.0 g）、2-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン（5.4 g）のエタノール（25 ml）溶液に、トリエチルアミン（4.5 g）を加えて、混合物を一晩加熱還流した。混合物を水に注いで、クロロホルムで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去し、化合物（9）（5.98 g）を得て、このまま次の反応に用いた。

【0060】

化合物（9）（4.9 g）、5-ヒドロキシ-2-ニトロベンゾトリフルオリド（3.2 g）、およびトリフェニルホスフィン（5.6 g）のTHF（30 ml）溶液に、氷冷下、アゾジカルボン酸ジイソプロピルエステル（4.3 g）のTHF（30 ml）溶液を滴下した。混合物を室温に昇温して3時間攪拌した後、減圧濃縮した。残渣をカラムクロ

マトグラフィーにより精製し、標記化合物 (5.98 g) を得た。

viscous oil. ^1H NMR (CDCl₃) δ 1.86 - 1.97 (m, 2H), 2.04 - 2.14 (m, 2H), 3.64 - 3.72 (m, 2H), 3.90 - 3.99 (m, 2H), 4.71 - 4.77 (m, 1H), 6.70 (d, 1H), 7.13 (d, 1H), 7.32 (d, 1H), 7.65 (d, 1H), 8.02 (d, 1H), 8.41 (s, 1H)

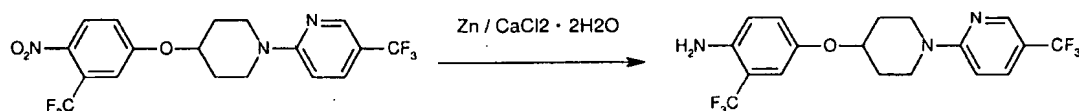
【0061】

実施例 2

4 - [4 - Amino - 3 - (trifluoromethyl) phenoxy] - 1 - [5 - (trifluoromethyl) - 2 - pyridyl] piperidine の製造 (化合物番号 1 - 14)

【0062】

【化 7】



【0063】

実施例 1 で得られたピペリジン (化合物番号 1 - 12、5.7 g) のエタノール (300 ml) 溶液に、亜鉛末 (18.8 g)、塩化カルシウム 2 水和物 (1.9 g) を加えて、混合物を一晩加熱還流した。混合物を室温まで冷やした後に、セライトを通してろ過し、ろ液を減圧濃縮した。残渣をクロロホルムで希釈し、水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去して、標記化合物 (5.4 g) を得た。

$n_D^{21.6}$ 1.5259. ^1H NMR (CDCl₃) δ 1.77 - 1.88 (m, 2H), 1.94 - 2.04 (m, 2H), 3.53 - 3.61 (m, 2H), 3.90 - 3.99 (m, 4H), 4.38 - 4.45 (m, 1H), 6.69 (t, 2H), 7.00 (d, 1H), 7.04 (d, 1H), 7.62 (d, 1H), 8.39 (s, 1H)

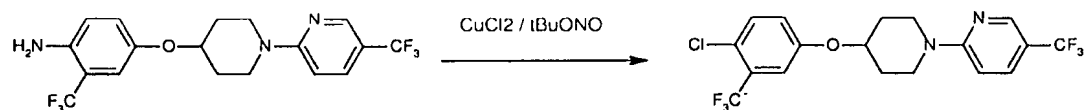
【0064】

実施例 3

4 - [4 - Chloro - 3 - (trifluoromethyl) phenoxy] - 1 - [5 - (trifluoromethyl) - 2 - pyridyl] piperidine の製造 (化合物番号 1 - 15)

【0065】

【化 8】



【0066】

塩化銅 (II) (0.14 g) のアセトニトリル (5 ml) 懸濁液に、水冷下、亜硝酸 t-ブチル (0.13 g) を滴下した。混合物を 10 分間攪拌した後に、水冷下、実施例 2 で得られたピペリジン (化合物番号 1 - 14、0.35 g) のアセトニトリル (3 ml) 溶液を加えた。混合物を室温に昇温してさらに 1 時間攪拌した。混合物を氷水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物 (0.2 g) を得た。

$n_D^{21.9}$ 1.5275. ^1H NMR (CDCl₃) δ 1.82 - 1.92 (m, 2H), 1.99 - 2.08 (m, 2H), 3.60 - 3.68 (m, 2H), 3.89 - 3.97 (m, 2H), 4.56 - 4.63 (m, 1H), 6.69 (d, 1H), 7.01 (d, 1H), 7.24 (d, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.63 (d, 1H), 8.40 (s, 1H)

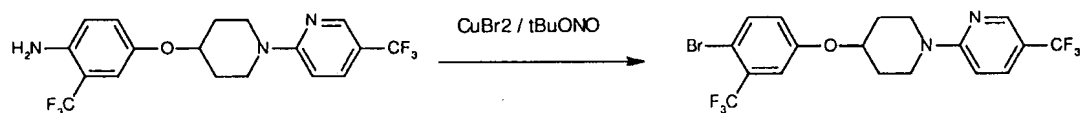
【0067】

実施例 4

4 - [4 - Bromo - 3 - (trifluoromethyl) phenoxy] - 1 - [5 - (trifluoromethyl) - 2 - pyridyl] piperidine の製造 (化合物番号 1 - 16)

【0068】

【化9】



【0069】

臭化銅(II) (0.22 g) のアセトニトリル (5 ml) 懸濁液に、水冷下、亜硝酸 t-ブチル (0.12 g) を滴下した。混合物を10分間攪拌した後に、水冷下、実施例2で得られたピペリジン (化合物番号1-14、0.32 g) のアセトニトリル (2 ml) を加えた。混合物を室温に昇温してさらに2.5時間攪拌した。混合物を水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物 (0.21 g) を得た。

$n_D^{21.9}$ 1.5365. $^1\text{H NMR}$ (CDCl₃) δ 1.81 - 1.92 (m, 2H), 1.99 - 2.08 (m, 2H), 3.60 - 3.68 (m, 2H), 3.88 - 3.96 (m, 2H), 4.57 - 4.63 (m, 1H), 6.68 (d, 1H), 6.94 (d, 1H), 7.24 (s, 1H), 7.58 (s, 1H), 7.63 (d, 1H), 8.40 (s, 1H)

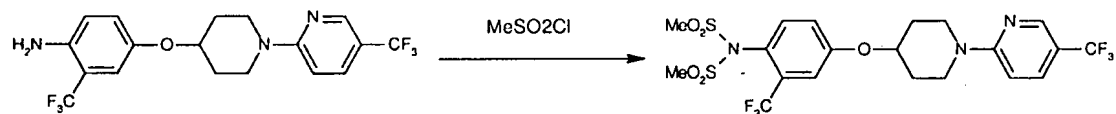
【0070】

実施例5

4-[4-[Bis(methylsulfonyl)amino]-3-(trifluoromethyl)phenoxy]-1-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]piperidine の製造 (化合物番号1-17)

【0071】

【化10】



【0072】

実施例2で得られたピペリジン (化合物番号1-14、0.32 g) のTHF (5 ml) 溶液に、水冷下、メタンスルホニルクロリド (0.09 g) とトリエチルアミン (0.08 g) を加えた。混合物を室温に昇温して4時間攪拌し、さらに3.5時間加熱還流した。混合物を室温まで冷やした後に、水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物 (0.20 g) を得た。

amorphous $^1\text{H NMR}$ (CDCl₃) δ 1.87 - 1.96 (m, 2H), 2.01 - 2.10 (m, 2H), 3.47 (s, 6H), 3.64 - 3.73 (m, 2H), 3.88 - 3.96 (m, 2H), 4.64 - 4.69 (m, 1H), 6.70 (d, 1H), 7.13 (d, 1H), 7.32 (d, 1H), 7.37 (d, 1H), 7.64 (d, 1H), 8.41 (s, 1H)

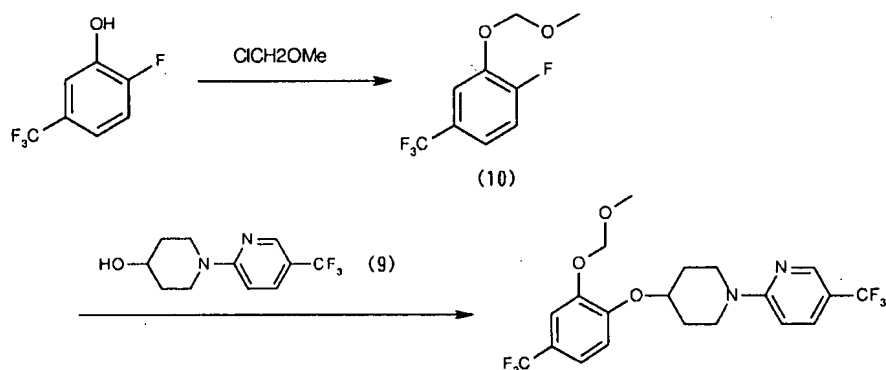
【0073】

実施例6

4-[2-(Methoxymethoxy)-4-(trifluoromethyl)phenoxy]-1-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]piperidine の製造 (化合物番号1-49)

【0074】

【化11】



【0075】

4-フルオロ-3-ヒドロキシベンゾトリフルオリド (0.36 g) の DMF (5 ml) 溶液に、60%水素化ナトリウム (88 mg) を加えて、氷冷下、クロロメチルメチルエーテル (0.24 g) を滴下し、混合物を室温に昇温して5時間攪拌した。混合物を水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去し、粗製の化合物 (10) (0.45 g) を得て、このまま次の反応に用いた。

ピベリジノール (9) (0.49 g) の DMF (5 ml) 溶液に、室温で、60%水素化ナトリウム (90 mg) を加えた。混合物を10分間攪拌した後に、ベンゾトリフルオリド (10) の DMF (5 ml) 溶液を加えて、約100℃まで昇温して、一晩攪拌した。混合物を室温まで冷やした後に、水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物 (0.56 g) を得た。

$n_D^{23.9}$ 1.4969. $^1\text{H NMR}$ (CDCl₃) δ 1.87 - 1.96 (m, 2H), 2.00 - 2.08 (m, 2H), 3.53 (s, 3H), 3.56 - 3.65 (m, 2H), 3.95 - 4.03 (m, 2H), 4.61 - 4.65 (m, 1H), 5.21 (s, 2H), 6.69 (d, 1H), 7.02 (d, 1H), 7.25 (d, 1H), 7.38 (s, 1H), 7.63 (d, 1H), 8.40 (s, 1H)

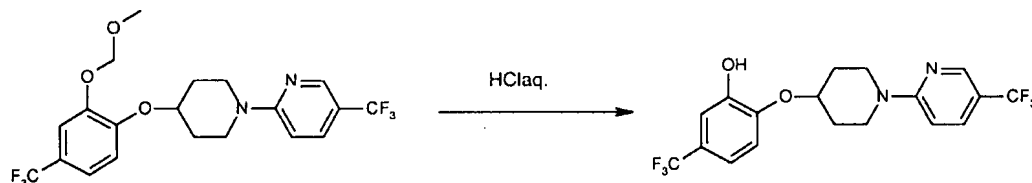
【0076】

実施例7

4-[2-Hydroxy-4-(trifluoromethyl)phenoxy]-1-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]piperidine の製造 (化合物番号1-50)

【0077】

【化12】



【0078】

実施例6で得られたピベリジン (化合物番号1-49、0.38 g) の THF (5 ml) 溶液に、室温で10%塩酸水 (5 ml) を加えた。混合物を2時間攪拌した後、10%塩酸水 (5 ml) を加えて、一晩攪拌した。混合物を水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和重曹水、食塩水で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去して、標記化合物 (0.31 g) を得た。

viscous oil. $^1\text{H NMR}$ (CDCl₃) δ 1.85 - 1.94 (m, 2H), 2.11 - 2.17 (m, 2H), 3.48 - 3.57 (m, 2H), 4.02 - 4.10 (m, 2H), 4.66 - 4.70 (m, 1H), 5.72 (s, 1H), 6.70 (d, 1H), 6.

95 (d, 1H), 7.13 (d, 1H), 7.20 (s, 1H), 7.65 (d, 1H), 8.41 (s, 1H)

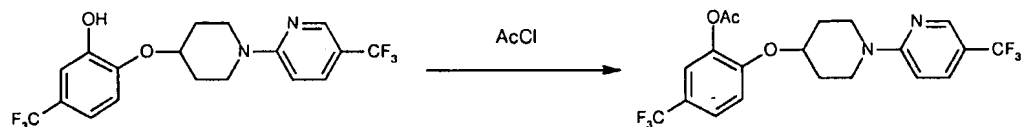
【0079】

実施例 8

4-[2-Acetoxy-4-(trifluoromethyl)phenoxy]-1-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]piperidine の製造 (化合物番号 1-57)

【0080】

【化13】



【0081】

実施例 7 で得られたピペリジン (化合物番号 1-50、0.17 g) とトリエチルアミン (50 mg) のアセトニトリル (5 ml) 溶液に、氷冷下、塩化アセチル (36 mg) を加えた。混合物を室温に昇温して 3 時間攪拌した後、水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を食塩水で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去して、標記化合物 (0.22 g) を得た。

m.p. 85-95°C. ¹H NMR (CDCl₃) δ 1.38-2.05 (m, 4H), 2.30 (s, 3H), 3.70-3.84 (m, 4H), 4.63-4.70 (m, 1H), 6.63 (d, 1H), 7.05 (d, 1H), 7.33 (s, 1H), 7.47 (d, 1H), 7.63 (d, 1H), 8.39 (s, 1H)

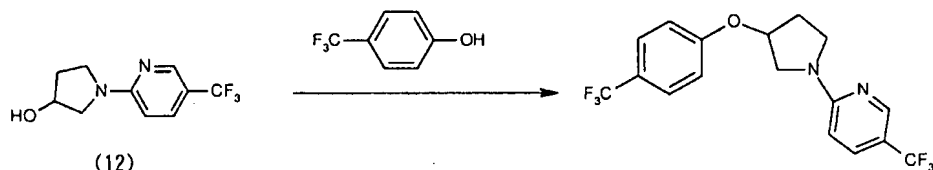
【0082】

実施例 9

3-[4-(trifluoromethyl)phenoxy]-1-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]pyrrolidine の製造 (化合物番号 1-93)

【0083】

【化14】



【0084】

ピロリジノール (12) (0.35 g) と 4-トリフルオロメチルフェノール (0.16 g) を用いて、実施例 1 と同様の方法により、標記化合物 (0.32 g) を得た。なお、ピロリジノール (12) は、実施例 1 の化合物 (9) と同様の方法により調製した。

m.p. 109-112°C. ¹H NMR (CDCl₃) δ 2.26-2.46 (m, 2H), 3.62-3.75 (m, 2H), 3.85 (s, 2H), 5.10-5.15 (m, 1H), 6.42 (d, 1H), 6.96 (d, 2H), 7.56 (d, 2H), 7.62 (d, 1H), 8.39 (s, 1H)

【0085】

実施例 10

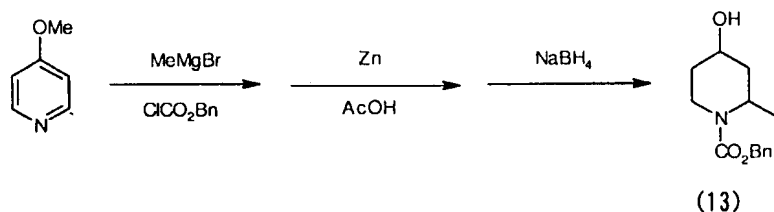
2-Methyl-4-[2-propoxy-4-(trifluoromethyl)phenoxy]-1-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]piperidine の製造 (化合物番号 1-88)

工程 1

1-Benzoyloxycarbonyl-2-methyl-4-piperidinol (13) の製造

【0086】

【化15】



【0087】

以下の反応は、Tetrahedron Lett. 1986, 27, 4549に記載された方法に従った。

4-メトキシピリジン (2.50 g) の THF (25 ml) 溶液に、 -30°C から -20°C に保ちながら、メチルマグネシウムブロミド (3.0 M エーテル溶液、7.6 ml) を滴下した。混合物を 10 分間攪拌した後、 -30°C から -20°C に保ち、クロロギ酸ベンジル (3.90 g) を滴下した。混合物を 30 分間攪拌した後、室温まで昇温した。混合物を 10% 塩酸に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を食塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去して油状物 (5.34 g) を得て、このまま次の反応に用いた。

【0088】

以下の反応は、J. Org. Chem., 2001, 66, 2181に記載された方法に従った。

この油状物を酢酸 (150 ml) に溶解し、室温で亜鉛 (21.4 g) を加えた。懸濁液を 6 時間加熱還流した。混合物を冷却後、セライトを通してろ過し、ろ液を減圧留去した。残渣に水を加え、水酸化ナトリウムで中和し、酢酸エチルで抽出した。有機層を食塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去して、油状物 (5.01 g) を得た。この油状物 (2.47 g) のエタノール (25 ml) 溶液に、室温で水素化ホウ素ナトリウム (0.38 g) を加え、混合物を 1 時間攪拌した。混合物を減圧濃縮し、水を加えて、酢酸エチルで抽出した。有機層を食塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去して、粗製の化合物 (13) (2.39 g) を得た。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ 1.16 - 1.93 (m, 7H), 2.95 - 3.37 (m, 1H), 3.88 - 4.70 (m, 3H), 5.13 (m, 2H), 7.35 (m, 5H)

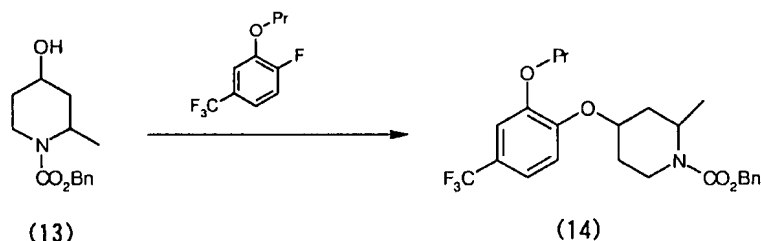
【0089】

工程 2

1-Benzyloxycarbonyl-2-Methyl-4-[2-propoxy-4-(trifluoromethyl) phenoxy] piperidine (14) の製造

【0090】

【化16】



【0091】

化合物 (13) の DMF (25 ml) に、室温で、60% 水素化ナトリウム (0.42 g) を加えた。混合物を 30 分間攪拌した後、4-フルオロ-3-プロポキシベンゾトリフルオライド (2.13 g) を加え、 100°C に昇温して一晩加熱した。混合物を室温まで冷やした後に、水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、化合物 (14) (1.02 g) を得た。

^1H NMR (CDCl₃) δ 1.05 (t, 3H), 1.26 (m, 3H), 1.50 - 2.04 (m, 6H), 3.00 - 3.40 (m, 1H), 3.92 - 4.16 (m, 3H), 4.50 - 4.73 (m, 2H), 5.15 (m, 2H), 6.93 (m, 1H), 7.10 (m, 2H), 7.33 (m, 5H).

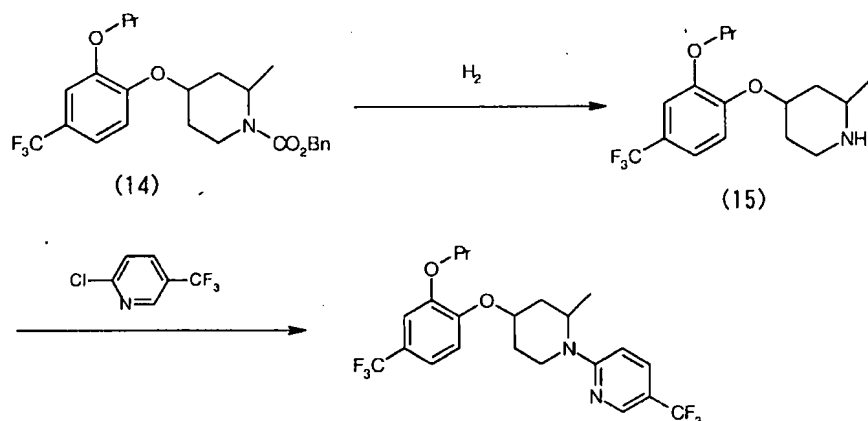
【0092】

工程3

2-Methyl-4-[2-propoxy-4-(trifluoromethyl)phenoxy]-1-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]piperidineの製造

【0093】

【化17】



【0094】

化合物(14)のエタノール(25 ml)溶液に、5%パラジウム-炭素(0.20 g)を加えた。この懸濁液を水素雰囲気下、80℃で8時間加熱した。混合物を冷却後、セライトを通してろ過した。ろ液を減圧留去して、粗製の化合物(15)(0.70 g)を得た。

このピペリジンのアセトニトリル(15 ml)溶液に、2-クロロ-5-(トリフルオロメチル)ピリジン(4.0 g)と炭酸カリウム(1.53 g)を加え、混合物を3日間加熱還流した。混合物を冷却後、水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物(30 mg)を得た。

viscous oil. ^1H NMR (CDCl₃) δ 1.04 (t, 3H), 1.23 (d, 3H), 1.71 - 1.97 (m, 4H), 2.10 - 2.26 (m, 2H), 3.05 (m, 1H), 3.98 (t, 2H), 4.43 (m, 1H), 4.63 (m, 1H), 4.88 (m, 1H), 6.61 (d, 1H), 7.00 - 7.26 (m, 3H), 7.62 (d, 1H), 8.39 (s, 1H)

【0095】

実施例11

3 α -[2-Methoxy-4-(trifluoromethyl)phenoxy]-8-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]-8-azabicyclo[3.2.1]octaneの製造(化合物番号2-7)

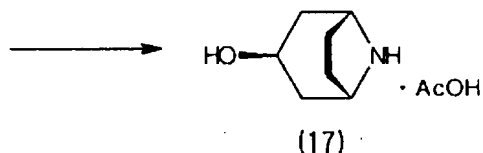
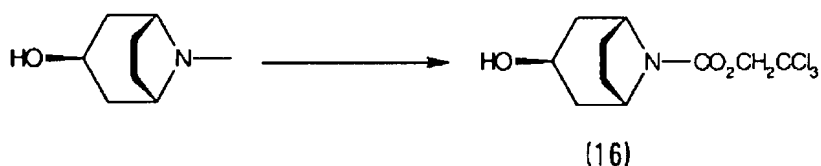
【0096】

工程1

3 α -hydroxy-8-azabicyclo[3.2.1]octane, acetic acid salt(17)の製造

【0097】

【化18】



【0098】

トロピン (14.1 g)、炭酸カリウム (1.4 g) のベンゼン (150 ml) 懸濁液に、クロロギ酸 2, 2, 2-トリクロロエチルエステル (23.3 g) を室温で加え、混合物を 3.5 時間加熱還流した。混合物を室温まで冷やした後に、水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去して、油状のカーボネート (16) を得て (30.08 g)、そのまま次の反応に用いた。

このカーボネート (16) の酢酸 (250 ml) 溶液に、亜鉛末 (65 g) を加えた。混合物を 5 分間攪拌した後に、80℃で 1 時間加熱した。混合物を室温まで冷やした後に、セライトを通してろ過した。ろ液を減圧留去して、粗製の (17) を得た (15.5 g)。

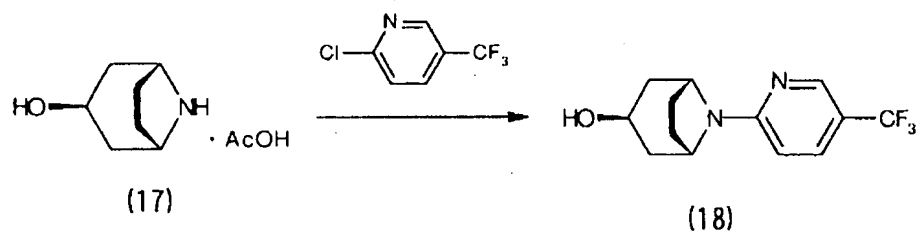
【0099】

工程 2

3α-hydroxy-8-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]-8-azabicyclo [3.2.1] octane (18) の製造

【0100】

【化19】



【0101】

粗製の化合物 (17) (5.64 g)、炭酸カリウム (41.5 g) および 2-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン (8.2 g) のアセトニトリル (150 ml) 懸濁液を 3.5 時間加熱還流した。混合物を室温まで冷やした後に、水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去し、結晶として化合物 (18) を得た (3.5 g)。

¹H NMR (CDCl₃) δ 1.42 (d, 1H), 1.77 (d, 2H), 2.05 - 2.20 (m, 4H), 2.32 - 2.39 (m, 2H), 4.09 (brs, 1H), 4.53 (brs, 2H), 6.52 (d, 1H), 7.58 (dd, 1H), 8.38 (d, 1H)

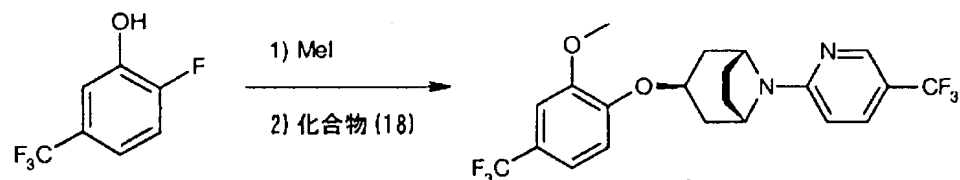
【0102】

工程 3

3α-[2-Methoxy-4-(trifluoromethyl)phenoxy]-8-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]-8-azabicyclo [3.2.1] octane の製造

【0103】

【化20】



【0104】

4-フルオロ-3-ヒドロキシベンゾトリフルオリド (0.17 g) の DMF (3 ml) 溶液に、水冷下、60%水素化ナトリウム (35 mg) を加えた。混合物を20分間攪拌した後、ヨードメタン (0.11 g) を加えて、60℃に昇温して40分間攪拌した。混合物を室温まで冷やした後に、化合物 (18) (0.22 g) と60%水素化ナトリウム (35 mg) を室温で加え、100℃で一晩加熱した。混合物を室温まで冷やした後に、氷水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残査をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物 (0.18 g) を得た。

viscous oil. ^1H NMR (CDCl₃) δ 2.00 – 2.22 (m, 6H), 2.38 – 2.44 (m, 2H), 3.90 (s, 3H), 4.56 – 4.61 (m, 3H), 6.56 (d, 1H), 6.77 (d, 1H), 7.10 (s, 1H), 7.16 (d, 1H), 7.60 (dd, 1H), 8.40 (brd, 1H)

【0105】

実施例 12

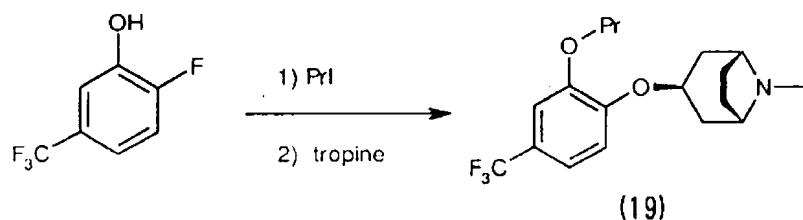
3 α -[2-Propoxy-4-(trifluoromethyl)phenoxy]-8-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]-8-azabicyclo[3.2.1]octaneの製造 (化合物番号 2-1)

工程 1

8-Methyl-3 α -[2-propoxy-4-(trifluoromethyl)phenoxy]-8-azabicyclo[3.2.1]octane (19) の製造

【0106】

【化21】



【0107】

4-フルオロ-3-ヒドロキシベンゾトリフルオリド (1.8 g) の DMF (15 ml) 溶液に、水冷下、60%水素化ナトリウム (0.44 g) を加えた。混合物を20分間攪拌した後、1-ヨードプロパン (1.7 g) の DMF (3 ml) 溶液を加えて、さらに4時間攪拌した。混合物にトロピン (1.42 g) と60%水素化ナトリウム (0.43 g) を室温で加え、100℃に昇温して一晩攪拌した。混合物を室温まで冷やした後に、氷水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残査をカラムクロマトグラフィーにより精製し、油状の化合物 (19) (1.1 g) を得た。

^1H NMR (CDCl₃) δ 1.08 (t, 3H), 1.83 (q, 2H), 1.90 – 2.20 (m, 8H), 2.30 (s, 3H), 3.10 – 3.11 (m, 2H), 3.95 (t, 2H), 4.58 (t, 1H), 6.79 (d, 1H), 7.05 (s, 1H), 7.13 (d, 1H)

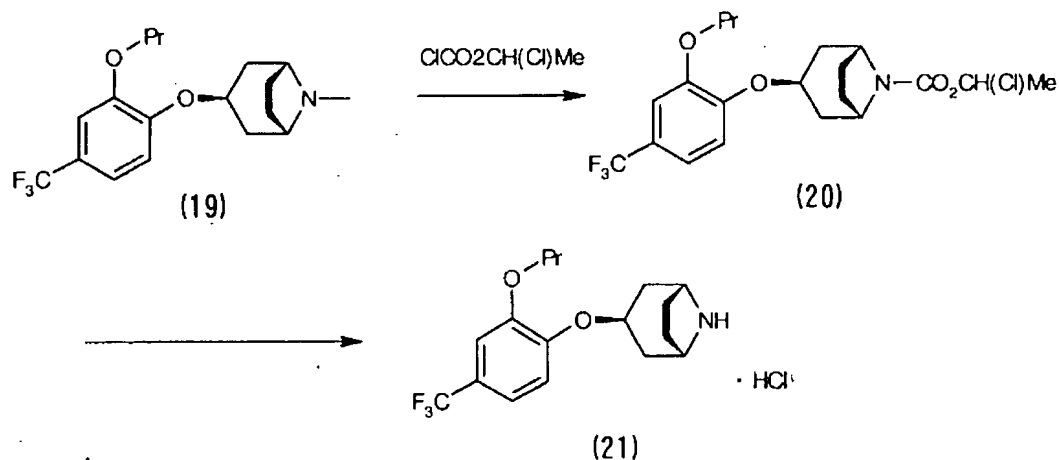
【0108】

工程 2

3 α - [2-propoxy-4-(trifluoromethyl) phenoxy] - 8-azabicyclo [3. 2. 1] octane, hydrochloric acid salt (21) の製造

【0109】

【化22】



【0110】

化合物 (19) (1.0 g) の塩化メチレン (6 ml) 溶液に、室温で、クロロギ酸 1-クロロエチルエステル (0.83 g) の塩化メチレン (4 ml) 溶液を加えて、混合物を一晩加熱還流した。混合物を塩化メチレンで希釈し、飽和重曹水、食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去して、粗製のカーボネート (20) を得て、このまま次の反応に用いた。

化合物 (20) にメタノール (6 ml) を加えて、2.5 時間加熱還流した。混合物を減圧濃縮して、粗製の (21) を得て、このまま次の反応に用いた。

¹H NMR of the salt-free (21) (CDCl₃) δ 1.10 (t, 3H), 1.61 (brs, 1H), 1.70 - 1.92 (m, 4H), 2.01 - 2.09 (m, 4H), 2.20 - 2.31 (m, 2H), 3.52 (brs, 2H), 3.95 (t, 2H), 4.63 - 4.65 (m, 1H), 6.78 (d, 1H), 7.06 (s, 1H), 7.15 (d, 1H).

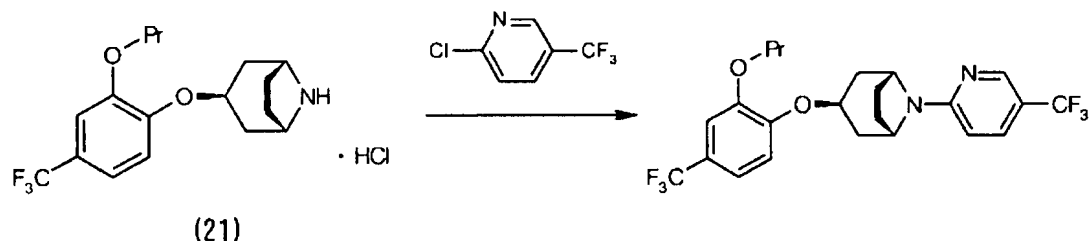
【0111】

工程 3

3 α - [2-Propoxy-4-(trifluoromethyl) phenoxy] - 8 - [5-(trifluoromethyl) - 2-pyridyl] - 8-azabicyclo [3. 2. 1] octane の製造

【0112】

【化23】



粗製の (21)、トリエチルアミン (1.18 g)、および 2-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン (0.53 g) のエタノール (10 ml) 溶液を一晩加熱還流した。混合物に、トリエチルアミン (3 g)、2-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン (1.6 g) およびエタノール (10 ml) を加えて、さらに、一晩加熱還流した。混合物を室温まで冷やした後に、水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残査をカラムクロマトグラフィー

ーにより精製し、標記化合物 (0.31 g) を得た。

m.p. 90–92 °C; ^1H NMR (CDCl_3) δ 1.09 (t, 3H), 1.82–1.93 (m, 2H), 2.01–2.23 (m, 6H), 2.43–2.50 (m, 2H), 3.97 (t, 2H), 4.56–4.62 (m, 3H), 6.55 (d, 1H), 6.77 (d, 1H), 7.08 (s, 1H), 7.15 (d, 1H), 7.60 (dd, 1H), 8.40 (s, 1H)

【0113】

実施例 13

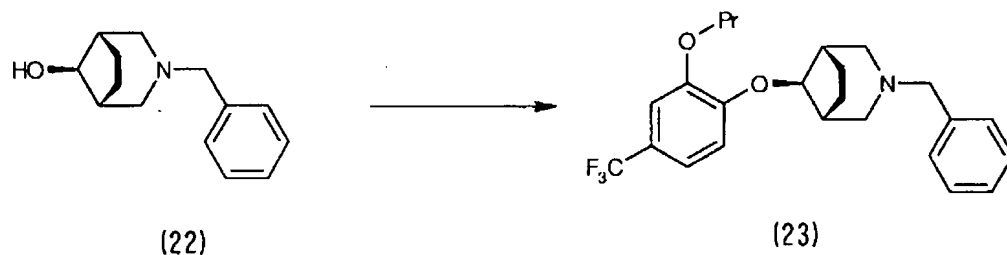
8 β -[2-Propoxy-4-(trifluoromethyl) phenoxy] - 3-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl] - 3-azabicyclo [3.2.1] octane の製造 (化合物番号 5-1)

工程 1

N-Benzyl-8 β -[2-Propoxy-4-(trifluoromethyl) phenoxy] - 3-azabicyclo [3.2.1] octane (23) の製造

【0114】

【化24】



【0115】

N-Benzyl-3-azabicyclo [3.2.1] octane-8 β -ol (22) は、J. Med. Chem. 2003, 46, 1456-1464に記載された方法で合成した。4-フルオロ-3-ヒドロキシベンゾトリフルオリド (0.50 g) の DMF (4 ml) 溶液に、水冷下、60%水素化ナトリウム (0.12 g) を加えた。混合物を室温下30分間攪拌した後、1-ヨードプロパン (0.51 g) を加えた。混合物を90 °Cに昇温して30分間攪拌した。混合物に (22) (0.41 g) の DMF (4 ml) 溶液と60%水素化ナトリウム (0.09 g) を室温で加え、15分間攪拌した後、100 °Cに昇温して2時間攪拌した。混合物を室温まで冷やした後に、水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、油状の (23) (0.75 g) を得た。

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.05 (t, 3H), 1.75–1.91 (m, 6H), 2.19 (d, 2H), 2.34 (brs, 2H), 2.74 (d, 2H), 3.51 (s, 2H), 3.96 (t, 2H), 4.33 (s, 1H), 6.94 (d, 1H), 7.07 (s, 1H), 7.13 (d, 1H), 7.20–7.34 (m, 5H).

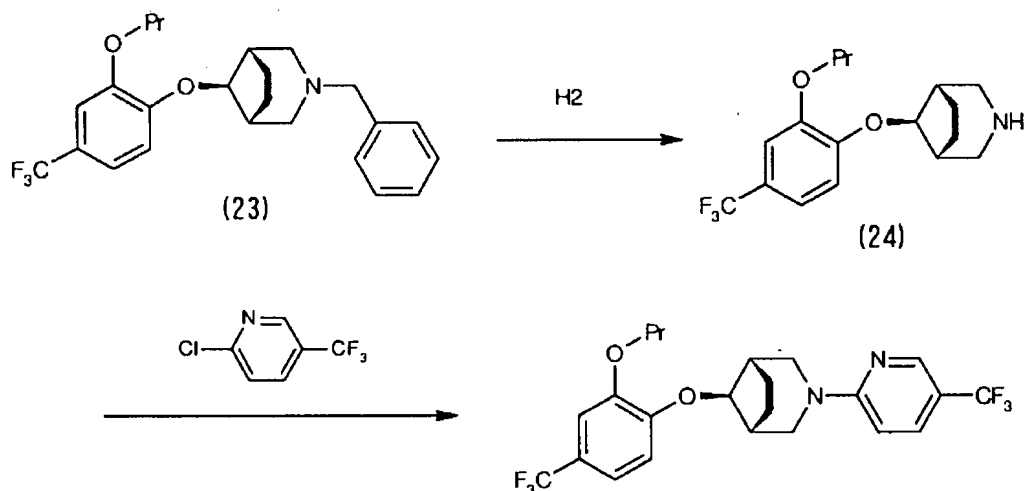
【0116】

工程 2

8 β -[2-Propoxy-4-(trifluoromethyl) phenoxy] - 3-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl] - 3-azabicyclo [3.2.1] octane の製造

【0117】

【化25】



【0118】

化合物(23)(0.66g)のエタノール(20ml)溶液に、10%パラジウム-炭素(0.13g)を加えた。この懸濁液を水素雰囲気下、室温で一晩攪拌した。混合物をセライトを通してろ過し、ろ液を減圧留去して、粗製の(24)(0.55g)を得た。

粗製の化合物(24)(0.55g)のアセトニトリル(12ml)溶液に、2-クロロ-5-(トリフルオロメチル)ピリジン(0.57g)と炭酸カリウム(0.66g)を加え、混合物を22時間加熱還流した。混合物を冷却後、水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物(0.26g)を得た。

mp. 48-50°C $^1\text{H NMR}$ (CDCl₃) δ 1.06(t, 3H), 1.57-1.63(m, 2H), 1.85(sext, 2H), 2.03-2.06(m, 2H), 2.57(brs, 2H), 3.08(d, 2H), 3.98(t, 2H), 4.15(d, 2H), 4.63(s, 1H), 6.60(d, 1H), 7.01(d, 1H), 7.11(s, 1H), 7.18(d, 1H), 7.62(d, 1H), 8.39(s, 1H)

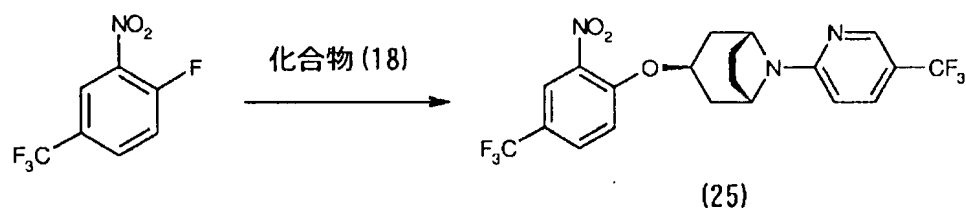
【0119】

実施例14

3- α -[2-Nitro-4-(trifluoromethyl)phenoxy]-8-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]-8-azabicyclo[3.2.1]octaneの製造(化合物番号2-13)

【0120】

【化26】



【0121】

実施例11、工程2で得られた化合物(18)(5g)のDMF(50ml)溶液に、氷冷下、60%水素化ナトリウム(0.81g)を加えた。混合物を室温で30分間攪拌した後、4-フルオロ-3-ニトロベンゾトリフルオリド(3.84g)を加えた。混合物を室温で1時間攪拌した後、100℃に昇温して一晩攪拌した。混合物を室温まで冷やした後に、氷水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネ

シウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物 (4.95 g) を得た。

viscous oil. $^1\text{H NMR}$ (CDCl₃) δ 2.01 – 2.36 (m, 8H), 4.59 (brs, 2H), 4.75 (t, 1H), 6.58 (d, 1H), 7.01 (d, 1H), 7.63 (d, 1H), 7.76 (d, 1H), 8.12 (s, 1H), 8.40 (s, 1H)

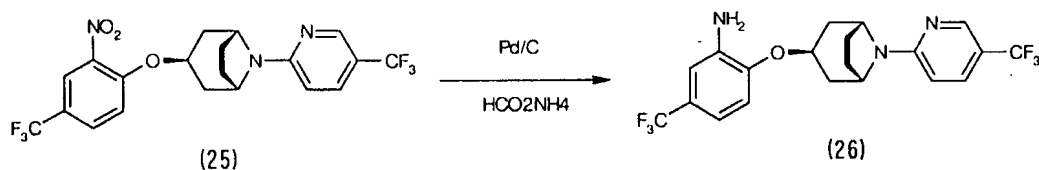
【0122】

実施例 15

3 α – [2-Amino-4-(trifluoromethyl) phenoxy] – 8 – [5-(trifluoromethyl) – 2-pyridyl] – 8-azabicyclo [3.2.1] octane の製造 (化合物番号 2-14)

【0123】

【化27】



【0124】

実施例 14 で得られた化合物 (25) (2.14 g) のメタノール (24 ml) 溶液に、10% パラジウム-炭素 (0.21 g) とギ酸アンモニウム (1.43 g) を加えた。混合物を室温で 1 時間攪拌した。混合物をセライトを通してろ過し、ろ液を減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物 (26) (1.86 g) を得た。

mp. 87 – 91 °C $^1\text{H NMR}$ (CDCl₃) δ 2.03 – 2.30 (m, 8H), 3.95 (s, 2H), 4.59 – 4.64 (m, 3H), 6.56 (d, 1H), 6.62 (d, 1H), 6.94 (s, 1H), 6.96 (s, 1H), 7.62 (d, 1H), 8.41 (s, 1H)

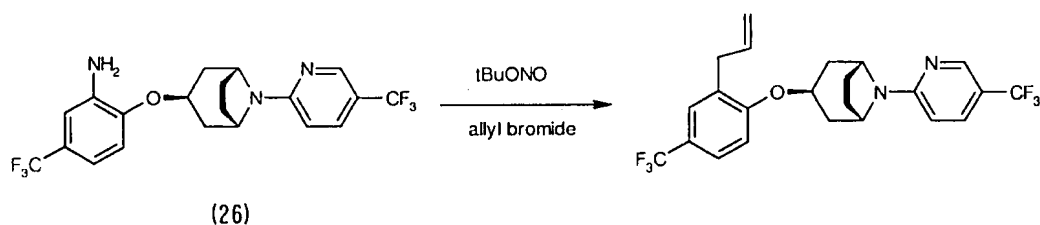
【0125】

実施例 16

3 α – [2-Allyl-4-(trifluoromethyl) phenoxy] – 8 – [5-(trifluoromethyl) – 2-pyridyl] – 8-azabicyclo [3.2.1] octane の製造 (化合物番号 2-15)

【0126】

【化28】



【0127】

以下の反応は、J. Org. Chem., 2002, 67, 6376-6381 に記載された方法に従った。窒素雰囲気下、亜硝酸 t-ブチル (0.18 g)、臭化アリル (2.1 g) のアセトニトリル (7.5 ml) 溶液に、室温で、実施例 15 で得られた化合物 (26) (0.5 g) を少量ずつ加えた。混合物を室温で 3 時間攪拌した後、水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物 (76 mg) を得た。

viscous oil. $^1\text{H NMR}$ (CDCl₃) δ 1.99 – 2.33 (m, 8H), 3.46 (d, 2H), 4.58 (brs, 3H), 5.08 – 5.15 (m, 2H), 5.94 – 6.07 (m, 1H), 6.57 (d, 1H), 6.69 (d, 1H), 7.42 (brs, 2H), 7.62 (d, 1H), 8.41 (s, 1H)

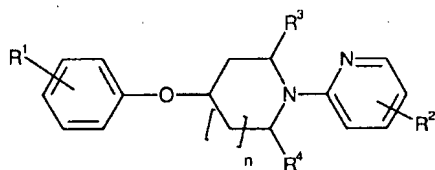
上記のようにして製造された本発明化合物の構造式と物理定数を第 2 表に示す。

【0128】

物性欄における visは粘稠物を、amorはアモルファスを示す。

【0129】

【表12】



化合物 番号	n	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	物理定数 [] : 融点 °C
1-1	1	4-OCF ₃	5-CF ₃	H	H	[30-32]
1-2	1	2, 3, 6-Cl ₃ -4- OCH ₂ CH=CCl ₂	3-Cl-5-CF ₃	H	H	[58-60]
1-3	1	2, 3, 6-Cl ₃ -4- OCH ₂ CH=CCl ₂	5-CF ₃	H	H	vis
1-4	1	4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	[48-50]
1-5	1	4-CF ₃	3-Cl-5-CF ₃	H	H	nD _{23.0} -1.5150
1-6	1	3-CF ₃	5-CF ₃	H	H	nD _{23.1} -1.5151
1-7	1	4-NO ₂	5-CF ₃	H	H	[140-144]
1-8	1	4-CN	5-CF ₃	H	H	[157-161]
1-9	1	4-CO ₂ Me	5-CF ₃	H	H	[124-126]
1-10	1	3-CF ₃ -4-F	5-CF ₃	H	H	nD _{23.1} -1.5071
1-11	1	4-OMe	5-CF ₃	H	H	[86-88]
1-12	1	3-CF ₃ -4-NO ₂	5-CF ₃	H	H	vis
1-13	1	3, 5- (CF ₃) ₂	5-CF ₃	H	H	nD _{21.6} -1.4889
1-14	1	3-CF ₃ -4-NH ₂	5-CF ₃	H	H	nD _{21.6} -1.5259
1-15	1	3-CF ₃ -4-Cl	5-CF ₃	H	H	nD _{21.9} -1.5275
1-16	1	3-CF ₃ -4-Br	5-CF ₃	H	H	nD _{21.9} -1.5365
1-17	1	3-CF ₃ -4-N (SO ₂ Me) ₂	5-CF ₃	H	H	amor
1-18	1	4-SCF ₃	5-CF ₃	H	H	[81-82]
1-19	1	4-OC (O) Ph	5-CF ₃	H	H	[154-156]
1-20	1	4-S (O) CF ₃	5-CF ₃	H	H	[83-86]
1-21	1	4-OCF ₂ Br	5-CF ₃	H	H	vis
1-22	1	4-OH	5-CF ₃	H	H	nD _{22.2} -1.5499
1-23	1	4-OCH ₂ Ph	5-CF ₃	H	H	[109-110]
1-24	1	4-Cl	5-CF ₃	H	H	[90-92]
1-25	1	4-Br	5-CF ₃	H	H	[87-90]
1-26	1	4-CF ₃	4-Me-6-CF ₃	H	H	nD _{23.2} -1.5089
1-27	1	4-OSO ₂ CF ₃	5-CF ₃	H	H	[52-54]
1-28	1	2-NO ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	[96-97]
1-29	1	2-NH ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	vis
1-30	1	2-Cl-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	nD _{21.8} -1.5210
1-31	1	2-Br-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	nD _{21.8} -1.5320
1-32	1	2-Cl-4-CF ₃ -6-NO ₂	5-CF ₃	H	H	[69-70]
1-33	1	2, 4-Me ₂	5-CF ₃	H	H	nD _{22.3} -1.5410
1-34	1	2-NH ₂ -4-CF ₃ -6-Cl	5-CF ₃	H	H	vis

【0130】

表 2 (続き)

化合物 番号	n	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	物理定数 [] : 融点 °C
1-35	1	2,6-Cl ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	[65-66]
1-36	1	2-Br-4-CF ₃ -6-Cl	5-CF ₃	H	H	[71-73]
1-37	1	2,4,6-Me ₃	5-CF ₃	H	H	nD _{22.2} -1.5339
1-38	1	2-F-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	[72-74]
1-39	1	2,4-(CF ₃) ₂	5-CF ₃	H	H	vis
1-40	1	2-Cl-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	vis
1-41	1	4-OCH ₂ (Naph-1-yl)	5-CF ₃	H	H	[123-124]
1-42	1	2-I-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	vis
1-43	1	2-CN-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	[101-102]
1-44	1	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	[55-65]
1-45	1	2-Me-4-Cl	5-CF ₃	H	H	nD _{22.9} -1.5505
1-46	1	2-OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	nD _{22.8} -1.5150
1-47	1	2-OEt-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	[50-53]
1-48	1	2-O ⁱ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	nD _{25.3} -1.5060
1-49	1	2-OCH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	nD _{23.9} -1.4969
1-50	1	2-OH-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	vis
1-51	1	2-Oallyl-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	[75-77]
1-52	1	2-Oallenyl-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	vis
1-53	1	2-Opropargyl-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	vis
1-54	1	2-O ⁿ Bu-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	[70-74]
1-55	1	2-O ⁿ Hex-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	[68-73]
1-56	1	2-Me-4-OCF ₃	5-CF ₃	H	H	nD _{24.4} -1.5089
1-57	1	2-OAc-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	[85-95]
1-58	1	2-Me-4-F	5-CF ₃	H	H	nD _{24.3} -1.5373
1-59	1	2-Et-4-Cl	5-CF ₃	H	H	nD _{24.6} -1.5445
1-60	1	2-CH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	nD _{26.2} -1.5110
1-61	1	2-CH ₂ OEt-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	nD _{23.3} -1.5090
1-62	1	2-OEt-4-CF ₃	5-Cl	H	H	vis
1-63	1	2-OC(O)OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	nD _{23.9} -1.5000
1-64	1	2-OCH ₂ ^c Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	[49-51]
1-65	1	2-OC(O)SMe-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	[77-79]
1-66	1	2-NHEt-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	vis
1-67	1	2- ⁿ Pr-4-Cl	5-CF ₃	H	H	nD _{24.9} -1.5394
1-68	1	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	Me	H	H	nD _{21.4} -1.5295
1-69	1	2-(OCH ₂ CH=CCl ₂)-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	[93-95]
1-70	1	2-O ⁱ Bu-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	[103-104]
1-71	1	2-O(CH ₂) ₂ OCH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	vis
1-72	1	2-OCH ₂ ⁱ Bu-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	vis
1-73	1	2-CH ₂ OCH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	vis
1-74	1	2-O(CH ₂) ₂ OH-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	nD _{22.2} -1.5121
1-75	1	2-N(ⁿ Pr) ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	nD _{22.0} -1.5121
1-76	1	2-NH ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	vis

【表 1 4】

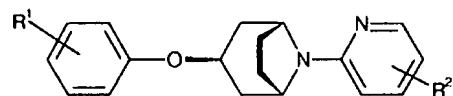
表 2 (続き)

化合物 番号	n	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	物理定数 [] : 融点 °C
1-77	1	2-N (Ac) ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	[110-114]
1-78	1	2-O (CH ₂) 2Cl-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	vis
1-79	1	2-allyl-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	vis
1-80	1	2-CHO-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	[85-90]
1-81	1	2-CH (OH) Et-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	vis
1-82	1	2-CH ₂ OH-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	vis
1-83	1	2-O (CH ₂) 2Br-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	[82-84]
1-84	1	2-O (CH ₂) 2OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	[51-54]
1-85	1	2-C (O) Et-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	vis
1-86	1	2-CH ₂ OCH ₂ OEt-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	nD _{22.5} -1.5069
1-87	1	2- ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	nD _{22.5} -1.5141
1-88	1	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	Me	H	vis
1-89	1	2-Cl-6-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	[70-72]
1-90	1	2-CH ₂ Cl-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	vis
1-91	1	2-CH (Cl) Et-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	vis
1-92	1	2-CH=CHMe-4-CF ₃ (trans)	5-CF ₃	H	H	[68-71]
1-93	0	4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	[109-112]
1-94	0	4-OCF ₃	5-CF ₃	H	H	[35-38]
1-95	0	2-O ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	H	H	[47-50]

【 0 1 3 2】

【表 1 5】

表 3

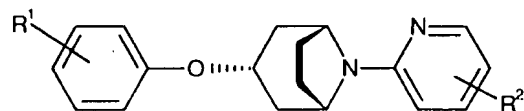


化合物番号	R ¹	R ²	物理定数 [] : 融点 °C
2-1	2-0 ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	[90-92]
2-2	2-CH ₂ OCH ₂ OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	vis
2-3	2-CH ₂ OCH ₂ OEt-4-CF ₃	5-CF ₃	vis
2-4	2-CH ₂ OEt-4-CF ₃	5-CF ₃	[91-93]
2-5	2-Cl-4-CF ₃	5-CF ₃	vis
2-6	2-Cl-6-0 ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	vis
2-7	2-OMe-4-CF ₃	5-CF ₃	vis
2-8	2-OEt-4-CF ₃	5-CF ₃	vis
2-9	2-0 ⁿ Bu-4-CF ₃	5-CF ₃	[68-71]
2-10	2-0 ⁿ Pen-4-CF ₃	5-CF ₃	vis
2-11	2-0allyl-4-CF ₃	5-CF ₃	vis
2-12	2- ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	vis
2-13	2-NO ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	vis
2-14	2-NH ₂ -4-CF ₃	5-CF ₃	[87-89]
2-15	2-allyl-4-CF ₃	5-CF ₃	vis

【0 1 3 3】

【表 1 6】

表 4



化合物番号	R ¹	R ²	物理定数 [] : 融点 °C
3-1	4-OCF ₃	5-CF ₃	[92-93]
3-2	2-allyl-4-CF ₃	5-CF ₃	vis
3-3	2-0 ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	[56-58]

【0 1 3 4】

【表 1 7】

表 5

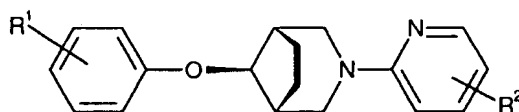


化合物番号	R ¹	R ²	物理定数 [] : 融点 °C
4-1	2-0 ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	[55-57]

【0 1 3 5】

【表 1 8】

表 6



化合物番号	R ¹	R ²	物理定数 [] : 融点 °C
5-1	2-0 ⁿ Pr-4-CF ₃	5-CF ₃	[48-50]

【0 1 3 6】

NMR データ

¹H-NMR (CDCl₃)

化合物番号 1-29 (28-2611)

δ 1.85 - 1.95 (m, 2H), 2.05 - 2.24 (m, 2H), 3.57 - 3.65 (m, 2H), 3.93 - 4.01 (m, 4H), 4.62 - 4.69 (m, 1H), 6.68 (d, 1H), 6.86 (d, 1H), 6.96 (a set of s and d, 2H), 7.63 (d, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物番号 1-39 (28-2648)

δ 1.98 - 2.05 (m, 4H), 3.69 - 3.78 (m, 2H), 3.86 - 3.94 (m, 2H), 4.82 - 4.86 (m, 1H), 6.68 (d, 1H), 7.10 (d, 1H), 7.63 (d, 1H), 7.77 (d, 1H), 7.86 (s, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物番号 1-52 (28-2850)

δ 1.89 - 2.06 (m, 4H), 3.61 - 3.70 (m, 2H), 3.91 - 4.00 (m, 2H), 4.63 - 4.67 (m, 1H), 5.42 (d, 2H), 6.68 (d, 1H), 6.85 (t, 1H), 7.03 (d, 1H), 7.30 (d, 1H), 7.36 (s, 1H), 7.62 (d, 1H), 8.39 (s, 1H)

化合物番号 1-53 (28-2851)

δ 1.86 - 2.09 (m, 4H), 2.53 (t, 1H), 3.57 - 3.66 (m, 2H), 3.94 - 4.03 (m, 2H), 4.60 - 4.67 (m, 1H), 4.77 (d, 1H), 6.68 (d, 1H), 7.02 (d, 1H), 7.24 - 7.29 (m, 2H), 7.62 (d, 1H), 8.39 (s, 1H)

化合物番号 1-66 (28-2923)

δ 1.29 (t, 3H), 1.83 - 1.94 (m, 2H), 2.04 - 2.14 (m, 2H), 3.15 - 3.24 (m, 2H), 3.53 - 3.62 (m, 2H), 3.95 - 4.01 (m, 2H), 4.23 (brs, 1H), 4.61 - 4.67 (m, 1H), 6.68 (d, 1H)

), 6.77 - 6.89 (m, 3H), 7.63 (d, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物番号 1-73 (28-2954)

δ 1.88 - 2.09 (m, 4H), 3.41 (s, 3H), 3.66 - 3.74 (m, 2H), 3.84 - 3.93 (m, 2H), 4.66 (s, 2H), 4.68 - 4.75 (m, 3H), 6.68 (d, 1H), 6.95 (d, 1H), 7.52 (d, 1H), 7.63 (d, 1H), 7.71 (s, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物番号 1-76 (28-2960)

δ 1.00 (t, 3H), 1.67 (q, 2H), 1.86 - 1.93 (m, 2H), 2.06 - 2.12 (m, 2H), 3.07 - 3.15 (m, 2H), 3.55 - 3.63 (m, 2H), 3.93 - 4.01 (m, 2H), 4.32 (brs, 1H), 4.64 - 4.66 (m, 1H), 6.68 (d, 1H), 6.77 - 6.90 (m, 3H), 7.63 (d, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物番号 1-78 (28-2976)

δ 1.87 - 2.06 (m, 4H), 3.60 - 3.68 (m, 2H), 3.84 (t, 2H), 3.86 - 3.99 (m, 2H), 4.30 (t, 2H), 4.63 - 4.68 (m, 1H), 6.68 (d, 1H), 7.03 (d, 1H), 7.14 (s, 1H), 7.22 (d, 1H), 7.62 (d, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物番号 1-79 (28-2985)

δ 1.91 - 2.08 (m, 4H), 3.42 (d, 2H), 3.74 - 3.86 (m, 4H), 4.69 - 4.71 (m, 1H), 5.04 - 5.10 (m, 2H), 5.91 - 6.00 (m, 1H), 6.68 (d, 1H), 6.92 (d, 1H), 7.42 - 7.47 (m, 2H), 7.64 (d, 1H), 8.41 (s, 1H)

化合物番号 1-81 (28-2994)

δ 0.97 (t, 3H), 1.74 - 1.95 (m, 4H), 2.04 - 2.14 (m, 3H), 3.66 - 3.73 (m, 2H), 3.85 - 3.94 (m, 2H), 4.71 - 4.74 (m, 1H), 4.93 - 4.96 (m, 1H), 6.69 (d, 1H), 6.94 (d, 1H), 7.49 (d, 1H), 7.64 (d, 1H), 7.69 (s, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物番号 2-2 (28-3000)

δ 2.00 - 2.31 (m, 8H), 3.44 (s, 3H), 4.58 - 4.64 (m, 3H), 4.70 (s, 2H), 4.79 (s, 2H), 6.57 (d, 1H), 6.72 (d, 1H), 7.50 (d, 1H), 7.63 (d, 1H), 7.72 (s, 1H), 8.41 (s, 1H)

化合物番号 2-3 (28-3020)

δ 1.25 (t, 3H), 2.00 - 2.29 (m, 8H), 3.68 (q, 2H), 4.58 - 4.64 (m, 3H), 4.71 (s, 2H), 4.84 (s, 2H), 6.57 (d, 1H), 6.72 (d, 1H), 7.49 (d, 1H), 7.63 (d, 1H), 7.72 (s, 1H), 8.41 (s, 1H)

化合物番号 2-8 (28-3101)

δ 1.46 (t, 3H), 2.00 - 2.21 (m, 6H), 2.44 - 2.46 (m, 2H), 4.10 (q, 2H), 4.55 (brs, 2H), 4.61 (brs, 1H), 6.56 (d, 1H), 6.78 (d, 1H), 7.08 (d, 1H), 7.15 (d, 1H), 7.60 (d, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物番号 2-11 (28-3117)

δ 2.01 - 2.31 (m, 6H), 2.40 - 2.47 (m, 2H), 4.56 - 4.63 (m, 5H), 5.32 (d, 1H), 5.46 (d, 1H), 6.01 - 6.14 (m, 1H), 6.55 (d, 1H), 6.78 (d, 1H), 7.11 (s, 1H), 7.17 (d, 1H), 7.61 (d, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物番号 3-2 (28-3074)

δ 1.78 - 1.93 (m, 4H), 2.14 - 2.19 (m, 4H), 3.28 (d, 2H), 4.69 (brs, 2H), 4.83 - 4.90 (m, 1H), 4.95 - 5.02 (m, 2H), 5.77 - 5.91 (m, 1H), 6.59 (d, 1H), 6.92 (d, 1H), 7.35 (s, 1H), 7.41 (d, 1H), 7.65 (d, 1H), 8.43 (s, 1H)

【0137】

製剤実施例

(殺虫・殺ダニ剤)

次に、本発明の組成物の実施例を若干示すが、添加物及び添加割合は、これら実施例に限定されるべきものではなく、広範囲に変化させることが可能である。製剤実施例中の部は重量部を示す。

【0138】

製剤実施例 1 水和剤

本発明化合物

40部

珪藻土	53部
高級アルコール硫酸エステル	4部
アルキルナフタレンスルホン酸塩	3部

以上を均一に混合して微細に粉砕すれば、有効成分40%の水和剤を得る。

【0139】

製剤実施例2 乳剤

本発明化合物	30部
キシレン	33部
ジメチルホルムアミド	30部
ポリオキシエチレンアルキルアリルエーテル	7部

以上を混合溶解すれば、有効成分30%の乳剤を得る。

【0140】

製剤実施例3 粉剤

本発明化合物	10部
タルク	89部
ポリオキシエチレンアルキルアリルエーテル	1部

以上を均一に混合して微細に粉砕すれば、有効成分10%の粉剤を得る。

【0141】

製剤実施例4 粒剤

本発明化合物	5部
クレー	73部
ベントナイト	20部
ジオクチルスルホサキシネートナトリウム塩	1部
リン酸ナトリウム	1部

以上をよく粉砕混合し、水を加えてよく練り合せた後、造粒乾燥して有効成分5%の粒剤を得る。

【0142】

製剤実施例5 懸濁剤

本発明化合物	10部
リグニンスルホン酸ナトリウム	4部
ドデシルベンゼンスルホン酸ナトリウム	1部
キサンタンガム	0.2部
水	84.8部

以上を混合し、粒度が1ミクロン以下になるまで湿式粉砕すれば、有効成分10%の懸濁液を得る。

【0143】

試験例1 ナミハダニに対する効力

2寸鉢に播種したインゲンの発芽後7~10日を経過した第1本葉上に、有機リン剤抵抗性のナミハダニ雌成虫を17頭接種したのち、前記製剤実施例1に示された水和剤の処方に従い、化合物濃度が125ppmになるように水で希釈した薬液を散布した。温度25℃、湿度65%の恒温室内に置き、3日後に殺成虫率を調査した。試験は2反復である。その結果以下の化合物が100%の殺虫率を示した。

1-1、1-4、1-6、1-8、1-10、1-13、1-15、1-16、1-18、
1-20、1-21、1-24、1-25、1-27、1-29、1-30、1-31、
1-33、1-35、1-36、1-37、1-38、1-39、1-42、1-44、
1-45、1-46、1-47、1-48、1-49、1-51、1-52、1-53、
1-54、1-56、1-58、1-59、1-60、1-61、1-62、1-64

、 1-66、 1-67、 1-68、 1-70、 1-71、 1-72、 1-73、 1-74
、 1-75、 1-76、 1-78、 1-79、 1-81、 1-83、 1-84、 1-85
、 1-86、 1-87、 1-88、 1-89、 1-90、 1-91、 1-92、 1-93
、 1-94、 2-1、 2-2、 2-3、 2-4、 2-5、 2-6、 2-7、 2-8、 2-
9、 2-10、 2-11、 2-12、 2-15、 5-1

【0144】

試験例2 ミカンハダニに対する効力

シャーレに入れたミカン葉上に、殺ダニ剤抵抗性のミカンハダニの雌成虫を10頭接種したのち、前記製剤の実施例2に示された乳剤の処方に従い、化合物濃度が125ppmになるように水で希釈した薬液を回転散布塔にて散布した。温度25℃、湿度65%の恒温室内に置き、散布3日後に、成虫を除去し、この3日間に産付された卵に関し、成虫まで発育し得たか否かを11日目に調査した。その結果以下の化合物が100%の殺虫率を示した。

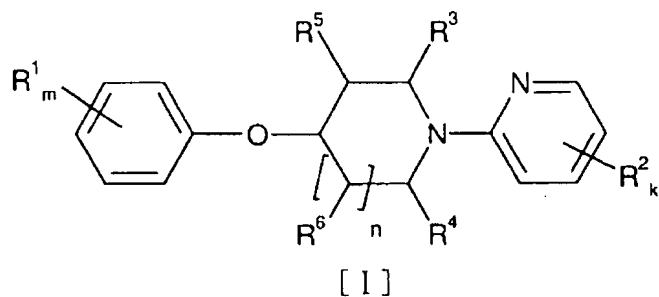
1-1、 1-4、 1-15、 1-21、 1-27、 1-30、 1-31、 1-39、 1-
42、 1-44、 1-46、 1-47、 1-48、 1-49、 1-51、 1-59、 1-
60、 1-61、 1-64、 1-68、 1-70、 1-73、 1-86、 1-87、 1-
88、 2-1、 2-2、 2-3、 2-4、 2-8、 2-9、 2-11、 5-1

【書類名】 要約書

【課題】 本発明は、有害生物防除剤となりうる新規化合物を提供することを課題とする。

【解決手段】 一般式（１）

【化１】



〔式中、 R^1 は、 C_{1-6} ハロアルキル基等、 R^2 は、 C_{1-6} ハロアルキル基等、 R^3 、 R^4 は
 R^5 および R^6 はそれぞれ独立して、水素原子、または C_{1-6} アルキル基等、または一緒にな
って飽和環を形成し、全体として橋かけ環を形成してもよい。〕
で表される化合物およびその塩の１種または２種以上を有効成分として含有することを特
徴とする有害生物防除剤。

出願人履歴

0 0 0 0 0 4 3 0 7

19900822

新規登録

東京都千代田区大手町 2 丁目 2 番 1 号
日本曹達株式会社